



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Lanraplenib**
CAS 号: **1800046-95-0**
产品货号: **S89430**

生物活性:

Description	Lanraplenib (GS-9876) 是一种高度选择性的口服 SYK 抑制剂 (IC50=9.5 nM) , 用于研究炎症性疾病。Lanraplenib (GS-9876) 通过糖蛋白 VI (GPVI) 受体抑制血小板中的 SYK 活性, 而不会延长猴子或人类的出血时间 (BT)。				
IC50 & Target	IC50: 9.5 nM (SYK)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	Ramos	EC50	24 nM	Inhibition of SYK in human Ramos cells assessed as reduction in antihuman IgM F(ab)2-induced phosphorylation of BLNK at Y96 residue preincubated for 1 hr followed by antihuman IgM F(ab)2 stimulation for 5 mins by MSD high bind plate assay	
In Vitro	Lanraplenib (GS-9876) 抑制人 B 细胞中抗 IgM 刺激的 AKT、BLNK、BTK、ERK、MEK 和 PKC δ 的磷酸化, EC50 值为 24-51 nM。Lanraplenib (GS-9876) 抑制 B 细胞上抗 IgM 介导的 CD69 和 CD86 表达 (EC50=112 nM 和 164 nM) 和抗 IgM/抗 CD40 共刺激 B 细胞增殖 (EC50=108 nM)。在人类巨噬细胞中, Lanraplenib (GS-9876) 抑制 IC 刺激的 TNF α 和 IL-1 β 释放 (EC50=121 nM 和 9 nM)[1]。 Lanraplenib (GS-9876) 抑制糖蛋白 VI (GPVI) 诱导的用于激活 T 细胞和磷脂酶 C γ 2 的接头磷酸化、人全血中的血小板活化和聚集以及血小板与动脉下胶原蛋白的结合流[2]。				
In Vivo	Lanraplenib (GS-9876) 抑制人 B 细胞中抗 IgM 刺激的 AKT、BLNK、BTK、ERK、MEK 和 PKC δ 的磷酸化, EC50 值为 24-51 nM。Lanraplenib (GS-9876) 抑制 B 细胞上抗 IgM 介导的 CD69 和 CD86 表达 (EC50=112 nM 和 164 nM) 和抗 IgM/抗 CD40 共刺激 B 细胞增殖 (EC50=108 nM)。在人类巨噬细胞中, Lanraplenib (GS-9876) 抑制 IC 刺激的 TNF α 和 IL-1 β 释放 (EC50=121 nM 和 9 nM)[1]。 Lanraplenib (GS-9876) 抑制糖蛋白 VI (GPVI) 诱导的用于激活 T 细胞和磷脂酶 C γ 2 的接头磷酸化、人全血中的血小板活化和聚集以及血小板与动脉下胶原蛋白的结合流[2]。				
Description	RD162 是一种二芳基硫代乙内酰脲, 一种口服有效的非甾体抗雄激素 (NSAA)。RD162 与雄激素受体 (AR) 特异性结合。RD162 在去势抵抗人前列腺癌小鼠模型中诱导肿瘤消退。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 20 mg/mL (45.10 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2548 mL	11.2740 mL	22.5479 mL
		5 mM	0.4510 mL	2.2548 mL	4.5096 mL
		10 mM	0.2255 mL	1.1274 mL	2.2548 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。					



	以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2 mg/mL (4.51 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2 mg/mL (4.51 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。
参考文献	[1]. Di Paolo J, et al. FRI0049 Preclinical Characterization of GS-9876, A Novel, Oral SYK Inhibitor That Shows Efficacy in Multiple Established Rat Models of Collagen-Induced Arthritis. Annals of the Rheumatic Diseases 2016;75:443-444. [2]. Clarke AS, et al. Effects of GS-9876, a novel spleen tyrosine kinase inhibitor, on platelet function and systemic hemostasis. Thromb Res. 2018 Oct;170:109-118. [3]. Kivitz AJ, et al. GS-9876, a Novel, Highly Selective, SYK Inhibitor in Patients with Active Rheumatoid Arthritis: Safety, Tolerability and Efficacy Results of a Phase 2 Study [abstract]. Arthritis Rheumatol. 2018; 70 (suppl 10).

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80° C, 6 months; -20° C, 1 month. -80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.2548 mL	11.2740 mL	22.5479 mL	56.3698 mL
	5 mM	0.4510 mL	2.2548 mL	4.5096 mL	11.2740 mL
	10 mM	0.2255 mL	1.1274 mL	2.2548 mL	5.6370 mL
	15 mM	0.1503 mL	0.7516 mL	1.5032 mL	3.7580 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	20 mM	0.1127 mL	0.5637 mL	1.1274 mL	2.8185 mL
	25 mM	0.0902 mL	0.4510 mL	0.9019 mL	2.2548 mL
	30 mM	0.0752 mL	0.3758 mL	0.7516 mL	1.8790 mL
	40 mM	0.0564 mL	0.2818 mL	0.5637 mL	1.4092 mL



源叶