



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: **Icerguastat (Synonyms: Sephin1; IFB-088)**

CAS 号: **951441-04-6**

产品货号: **S89627**

生物活性:

Description	Icerguastat (Sephin1) ， 一种缺乏 α 2-肾上腺素能活性的 Guanabenz 衍生物，是磷酸酶调节亚单位 PPP1R15A (R15A) 的选择性抑制剂。Icerguastat 抑制 eIF2 α 去磷酸化，从而延长保护反应。Icerguastat 具有抗朊病毒作用。				
In Vitro	Icerguastat (5 μ M) 在应激条件下延长少突胶质细胞中的 eIF2 α 磷酸化[1]。 Icerguastat (Sephin1) (一种全磷酸酶的选择性抑制剂)，在体内安全和选择性地抑制蛋白磷酸酶 1 的调节亚基。Icerguastat 选择性结合并抑制应激诱导的 PPP1R15A，但不结合和抑制相关的组成型 PPP1R15B，以延长适应性磷酸信号通路的益处，保护细胞免受其他致命的蛋白质错误折叠应激[2]。				
In Vivo	Icerguastat (4-8 mg/kg；腹腔注射；每日一次，持续 35 天) 可延缓 EAE (实验性自身免疫性脑脊髓炎) 的发作[1]。 Icerguastat (100 μ g；ip) 延长了感染朊病毒的小鼠的存活时间[3]。				
	Animal Model:	C57BL/6J female mice immunized with MOG35-55/CFA to induce chronic EAE[1]			
	Dosage:	4 mg/kg, 8 mg/kg			
	Administration:	I.p.; daily for 35 days			
	Result:	Significantly delayed clinical disease onset with both dosages, but to a greater extent with the 8 mg/kg treatment.			
	Animal Model:	Five-week-old female FVB mice (intracerebrally with mouse-adapted RML prions)[3]			
	Dosage:	100 μ g			
	Administration:	I.p.; 3 times per week for 60 days, after 60 days of treatment, the treatment was reduced to two i.p. injections per week for another 20 days.			
Result:	Significantly prolonged survival of prion-infected mice.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (254.27 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	5.0854 mL	25.4272 mL	50.8544 mL
		5 mM	1.0171 mL	5.0854 mL	10.1709 mL
		10 mM	0.5085 mL	2.5427 mL	5.0854 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℃, 6 months; -20℃, 1 month (protect from light)。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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：					



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

	——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: ≥ 2.08 mg/mL (10.58 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 20.8 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: 2.08 mg/mL (10.58 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液,悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 20.8 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]. Chen Y, et al. Sephin1, which prolongs the integrated stress response, is a promising therapeutic for multiple sclerosis. Brain. 2019;142(2):344-361. [2]. Das I, et al. Preventing proteostasis diseases by selective inhibition of a phosphatase regulatory subunit. Science. 2015;348(6231):239-242. [3]. Thapa S, et al. Sephin1 Reduces Prion Infection in Prion-Infected Cells and Animal Model. Mol Neurobiol. 2020;57(5):2206-2219.

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 (protect from light)。-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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	5.0854 mL	25.4272 mL	50.8544 mL	127.1359 mL
	5 mM	1.0171 mL	5.0854 mL	10.1709 mL	25.4272 mL
	10 mM	0.5085 mL	2.5427 mL	5.0854 mL	12.7136 mL
	15 mM	0.3390 mL	1.6951 mL	3.3903 mL	8.4757 mL
	20 mM	0.2543 mL	1.2714 mL	2.5427 mL	6.3568 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: shyysw@sina.com

	25 mM	0.2034 mL	1.0171 mL	2.0342 mL	5.0854 mL
	30 mM	0.1695 mL	0.8476 mL	1.6951 mL	4.2379 mL
	40 mM	0.1271 mL	0.6357 mL	1.2714 mL	3.1784 mL
	50 mM	0.1017 mL	0.5085 mL	1.0171 mL	2.5427 mL
	60 mM	0.0848 mL	0.4238 mL	0.8476 mL	2.1189 mL
	80 mM	0.0636 mL	0.3178 mL	0.6357 mL	1.5892 mL
	100 mM	0.0509 mL	0.2543 mL	0.5085 mL	1.2714 mL



源叶