



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: **Emavusertib**
CAS 号: **1801344-14-8**
产品货号: **S89715**

生物活性:

Description	Emavusertib is an orally active inhibitor for IRAK4 (IC50=57 nM) and FLT3. Emavusertib inhibits NF-κB and MyD88 signaling pathways, reduces the generation of pro-inflammatory cytokines like IL-6 and IL-10, thereby exhibiting anti-inflammatory and anti-proliferative activities against cancer cells, leading to cell apoptosis. Emavusertib exhibits antitumor activity in mouse model				
IC50 & Target	IRAK4 57 nM (IC50)				
In Vitro	与 IRAK-1 相比, Emavusertib (CA-4948) 对 IRAK-4 的选择性高 500 多倍。Emavusertib 减少 TNF-α、IL-1β、IL-6 和 IL-8 从 TLR 刺激的 THP-1 细胞中释放, IC50 <250 nM。由于抑制受体型酪氨酸蛋白激酶 FLT3, Emavusertib 还具有抗增殖活性[1]。 Emavusertib 对 IRAK-4 的结合亲和力比对 IRAK 1、2 和 3 的结合亲和力高出 350 倍以上[3]。 Emavusertib (10 μM, 72 h) 可降低边缘区淋巴瘤 (MZL) 细胞系中增殖细胞的百分比并诱导亚 G0 分数适度增加[3]。 Emavusertib (10 μM, 72 h) 可诱导 MZL 细胞凋亡细胞群显著增加, 尤其是与 Ibrutinib 联合使用时 [3]。				
In Vivo	Emavusertib (CA-4948) 在动物模型中表现出抗肿瘤活性, 包括含有 MyD88 基因突变的肿瘤。Emavusertib 在 FLT3 野生型和 FLT3 突变型急性髓性白血病 (AML) 小鼠模型中显示出抗白血病活性 [1]。 Emavusertib (25-150 mg/kg, 口服, 每日一次, 连续 14 天)可诱导小鼠肿瘤生长抑制[3]。				
	Animal Model:	Mice bearing OCI-LY10 tumors[3]			
	Dosage:	25, 50, or 150 mg/kg (once daily), 12.5, 25, or 50 mg/kg (twice daily)			
	Administration:	Orally, once daily or twice daily, for 14 consecutive days			
	Result:	Induced tumor growth inhibition. Emavusertib administered as a twice-daily divided dose was equivalent to the corresponding once-daily dose with regards to antitumor activity, i.e., 12.5 mg/kg BID versus 25 mg/kg QD.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (101.73 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	2.0346 mL	10.1729 mL	20.3459 mL
		5 mM	0.4069 mL	2.0346 mL	4.0692 mL
10 mM		0.2035 mL	1.0173 mL	2.0346 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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.23 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 ddH₂ O 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 (4.23 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.23 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，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 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 玉米油中，混合均匀。				
参考文献	[1]. Wiese MD, et al. Investigational IRAK-4 inhibitors for the treatment of rheumatoid arthritis. Expert Opin Investig Drugs. 2020 Apr 17:1-8. [2]. Guidetti F, et al. Targeting IRAK4 with Emavusertib in Lymphoma Models with Secondary Resistance to PI3K and BTK Inhibitors. J Clin Med. 2023 Jan 4;12(2):399. [3]. Parrondo RD, et al. IRAK-4 inhibition: emavusertib for the treatment of lymphoid and myeloid malignancies. Front Immunol. 2023 Oct 26;14:1239082.				
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℃, 1 year; -20℃, 6 months。-80℃ 储存时，请在 1 年内使用， -20℃ 储存时，请在 6 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



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

DMSO	1 mM	2.0346 mL	10.1729 mL	20.3459 mL	50.8647 mL
	5 mM	0.4069 mL	2.0346 mL	4.0692 mL	10.1729 mL
	10 mM	0.2035 mL	1.0173 mL	2.0346 mL	5.0865 mL
	15 mM	0.1356 mL	0.6782 mL	1.3564 mL	3.3910 mL
	20 mM	0.1017 mL	0.5086 mL	1.0173 mL	2.5432 mL
	25 mM	0.0814 mL	0.4069 mL	0.8138 mL	2.0346 mL
	30 mM	0.0678 mL	0.3391 mL	0.6782 mL	1.6955 mL
	40 mM	0.0509 mL	0.2543 mL	0.5086 mL	1.2716 mL
	50 mM	0.0407 mL	0.2035 mL	0.4069 mL	1.0173 mL
	60 mM	0.0339 mL	0.1695 mL	0.3391 mL	0.8477 mL
	80 mM	0.0254 mL	0.1272 mL	0.2543 mL	0.6358 mL
	100 mM	0.0203 mL	0.1017 mL	0.2035 mL	0.5086 mL

源叶