



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

产品名称: **Zegocractin**
CAS 号: **1713240-67-5**
产品货号: **T19256**

生物活性:

Description	Zegocractin (CM-4620) is a calcium-release activated calcium-channel (CRAC channel) inhibitor, with IC50s of 119 nM and 895 nM for Orai1/STIM1 and Orai2/STIM1 channels, respectively[1].			
IC50 & Target	IC50: 119 nM (Orai 1/STIM1), 895 nM (Orai 1/STIM1)[1]			
In Vitro	经测定, Zegocractin (化合物 1) 抑制 Orai 1/STIM1 通道的 IC50 为 119 nM, 抑制 Orai2/STIM1 通道的 IC50 为 895 nM。它在 Orai1 上比 Orai2 型 CRAC 通道更有效。在人 PBMC 中, Zegocractin 有效抑制在 T 细胞中发挥重要作用的多种细胞因子的释放 (IC50, IFN γ : 138 nM, IL-4: 879 nM, IL-6: 135 nM, IL-1 β : 240 nM, IL-10: 303 nM, TNF α : 225 nM, IL-2: 59 nM, IL-17 120 nM)[1]。			
In Vivo	用 CRAC 抑制剂 Zegocractin 或 GSK-7975A 处理小鼠 PAC, 并监测其钙摄取率。在用 700 nM 抑制剂处理后, 这两种 CRAC 抑制剂都将钙库操纵的钙进入 ER 的速率降低到对照水平的 50%。Zegocractin 在 10 mM 时可阻断 100% 的再摄取[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (237.10 mM; 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
		1 mM	2.3710 mL	11.8551 mL
		5 mM	0.4742 mL	2.3710 mL
		10 mM	0.2371 mL	1.1855 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: 2.08 mg/mL (4.93 mM); 悬浊液; 超声加热助溶 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 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline)			



	Solubility: 2.08 mg/mL (4.93 mM); 悬浊液; 超声加热助溶 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。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: 70% PEG300 $\rightarrow$ 30% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 10 mg/mL (23.71 mM); 悬浊液; 超声助溶
参考文献	[1]. ARYL SULFONOHYDRAZIDES. WO2016/138472A1.

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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3710 mL	11.8551 mL	23.7102 mL	59.2754 mL
	5 mM	0.4742 mL	2.3710 mL	4.7420 mL	11.8551 mL
	10 mM	0.2371 mL	1.1855 mL	2.3710 mL	5.9275 mL
	15 mM	0.1581 mL	0.7903 mL	1.5807 mL	3.9517 mL
	20 mM	0.1186 mL	0.5928 mL	1.1855 mL	2.9638 mL
	25 mM	0.0948 mL	0.4742 mL	0.9484 mL	2.3710 mL
	30 mM	0.0790 mL	0.3952 mL	0.7903 mL	1.9758 mL
	40 mM	0.0593 mL	0.2964 mL	0.5928 mL	1.4819 mL
	50 mM	0.0474 mL	0.2371 mL	0.4742 mL	1.1855 mL
	60 mM	0.0395 mL	0.1976 mL	0.3952 mL	0.9879 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

	80 mM	0.0296 mL	0.1482 mL	0.2964 mL	0.7409 mL
	100 mM	0.0237 mL	0.1186 mL	0.2371 mL	0.5928 mL



源叶