

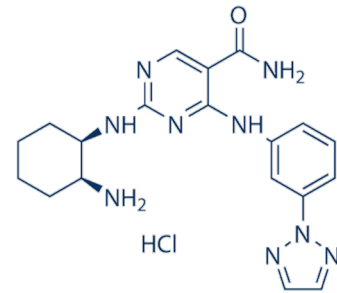
## PRT062607 HCl (Syk抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1166-10mM	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1166-5mg	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	5mg
SC1166-25mg	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[[[(1R,2S)-2-aminocyclohexyl]amino]-4-[3-(triazol-2-yl)anilino]pyrimidine-5-carboxamide;hydrochloride
简称	PRT062607 HCl
别名	AOB87122, CS-1488, AK340969, BC600301, HY-15323, W-6092, P505-15, BIIB057
中文名	N/A
化学式	C <sub>19</sub> H <sub>23</sub> N <sub>9</sub> O.HCl
分子量	429.91
CAS号	1370261-97-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 86mg/ml; DMSO 86mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.16ml DMSO, 或每4.30mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1166-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PRT062607 (P505-15, BIIB057) HCl是一种新型的, 高度选择性Syk抑制剂, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为1nM, 作用于Syk比作用于Fgr、Lyn、FAK、Pyk2和Zap70选择性高80倍以上。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	Syk	FGR	MLK1	YES	FLT3
IC <sub>50</sub>	1nM	81nM	88nM	123nM	139nM
体外研究	PRT062607(P505-15)具有抗SYK活性, 比作用于其它激酶的亲和力至少高80倍。PRT062607有效抑制B细胞抗原受体介导的B细胞信号和激活(IC <sub>50</sub> 分别为0.27和0.28μM), 且有效抑制Fce受体1介导的嗜碱性细胞脱粒(IC <sub>50</sub> 为0.15μM)。PRT062607作用于CLL细胞, 抑制BCR依赖性的趋化因子CCL3和CCL4分泌, 且抑制白血病细胞向组织归巢趋化因子CXCL12、CXCL13和间质细胞下方迁移。触发BCR后, PRT062607进一步抑制Syk和细胞外信号调节激酶的磷酸化。				
体内研究	药代动力学/药效学关系显示, 按30mg/kg剂量处理小鼠24小时期间, Syk抑制维持在70%。按15mg/kg剂量处理24小时, 抑制Syk范围为7.5%(Cmin)到78.4%(Cmax)平均抑制67%。PRT062607口服处理两种啮齿动物的类风湿关节炎模型, 产生抗炎活性, 这种作用存在剂量依赖性。在特异性抑制67%Syk活性的浓度时, 可观察到统计学显著疗效。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	在各种浓度PRT062607存在时, 测量Syk引起的底物磷酸化的程度。通过特异性作用于磷酸化酪氨酸的荧光抗体, 使用FRET的增加, 测定Syk活性, 检测十二种浓度用于剂量反应。通过测评PRT062607在270个独立的纯化激酶检测中的效果, 而测定激酶抑制的特异性和效力。PRT062607按一式两份实验用于分析。随后, 使用进行放射性检测, 测定IC <sub>50</sub> , 优化ATP浓度, 用于测定每个单独的激酶。进行所有放射性ATP摄入酶实验。

细胞实验	
细胞系	Syk依赖性的BaF3细胞

浓度	~6 $\mu$ M
处理时间	3天
方法	CellTiter Glo

动物实验	
动物模型	小鼠胶原蛋白抗体诱导性关节炎模型
配制	N/A
剂量	5, 15, 30mg/kg, 每天两次
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

- 1.Coffey G, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2012, 340(2), 350-359.
- 2.Hoellenriegel J, et al. Leukemia. 2012, 26(7), 1576-1583.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1166-10mM	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1166-5mg	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	5mg
SC1166-25mg	PRT062607 HCl (Syk抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01