

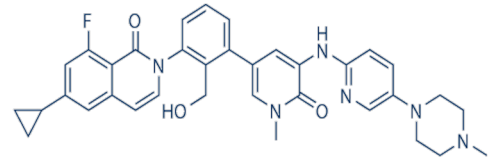
RN486 (BTK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1144-10mM	RN486 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1144-5mg	RN486 (BTK抑制剂)	5mg
SC1144-25mg	RN486 (BTK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-cyclopropyl-8-fluoro-2-[2-(hydroxymethyl)-3-[1-methyl-5-[[5-(4-methylpiperazin-1-yl)pyridin-2-yl]amino]-6-oxopyridin-3-yl]phenyl]isoquinolin-1-one
简称	RN486
别名	RN-486, RN 486
中文名	N/A
化学式	C ₃₅ H ₃₅ FN ₆ O ₃
分子量	606.69
CAS号	1242156-23-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 62mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.82ml DMSO, 或每6.07mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1144-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	RN486是一种有效的选择性BTK抑制剂, IC ₅₀ 为4nM。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	BTK	—	—	—	—
IC ₅₀	4nM	—	—	—	—
体外研究	RN486不仅能够有效地选择性抑制Btk酶, 并且对多种细胞类型的人类细胞试验中表现出功能活性, 阻断Fcε受体交联诱导的肥大细胞脱粒(IC ₅₀ =2.9nM), Fcγ受体衔接介导的单核细胞中肿瘤坏死因子α的产生(IC ₅₀ =7.0nM), 以及B细胞抗原受体诱导的一种活化标志物, CD69, 在全血B细胞中的表达(IC ₅₀ =21.0nM)。RN486能够阻断BCR信号, 如对B细胞中Btk和PLCγ2磷酸化显著的抑制。RN486在BioMAP体系中表现出选择性B细胞抑制性能。				
体内研究	RN486在啮齿动物模型中表现出相似的功能活性, 有效防止I型和III型超敏反应。更重要的是, 在小鼠CIA和大鼠佐剂性关节炎(AIA)模型中, RN486产生强的抗炎和骨保护作用。在AIA模型中, RN486单独或与methotrexate结合, 抑制关节和全身性炎症, 并减少足肿胀和血液中炎症标志物。				
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	基于荧光的酶试验用于测定Btk激酶活性和RN486对其的抑制。在试验中, 测试化合物与人重组Btk(10nM), ATP(100μM), 以及荧光标记的多肽底物(15μM)在30°C下培养15分钟。然后加入终止缓冲液停止反应, 反应产物使用Desktop Profiler 4 sipper进行定量。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1.Xu D, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2012, 341(1), 90-103.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1144-10mM	RN486 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1144-5mg	RN486 (BTK抑制剂)	5mg
SC1144-25mg	RN486 (BTK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