

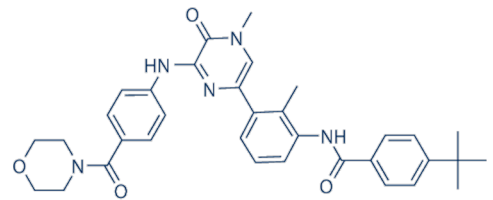
## CGI-1746 (BTK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1184-10mM	CGI-1746 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1184-5mg	CGI-1746 (BTK抑制剂)	5mg
SC1184-25mg	CGI-1746 (BTK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-tert-butyl-N-[2-methyl-3-[4-methyl-6-[4-(morpholine-4-carbonyl)anilino]-5-oxopyrazin-2-yl]phenyl]benzamide
简称	CGI-1746
别名	CGI 1746, CGI1746
中文名	N/A
化学式	C <sub>34</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>
分子量	579.69
CAS号	910232-84-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 33mg/ml
溶液配制	5mg加入0.86ml DMSO, 或每5.80mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1184-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	CGI1746是强效的高度选择性的小分子Btk抑制剂, 其IC50为1.9nM。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	BTK	—	—	—	—
IC50	1.9nM	—	—	—	—
体外研究	CGI1746对Btk具有特异性, 选择性比Tec和Src家族激酶高1000倍。在非ATP竞争性结合测试中, Btk的解离常数为1.5nM。CGI1746以新的结合模式抑制Btk活性, 其稳定了无活性非磷酸化的酶构象。CGI1746抑制对酶活化必要的自动和磷酸转移的步骤。CGI1746完全抑制抗IgM诱导的小鼠和人B细胞增殖, IC50s分别为134nM和42nM, 但是不影响抗CD3和抗CD28诱导的T细胞增殖。CGI1746有效抑制从四个捐赠人的扁桃腺中分离出的CD27 <sup>+</sup> IgG <sup>+</sup> B细胞的增殖, 平均IC50为112nM。在巨噬细胞中, CGI1746废除FcγRIII诱导的TNFα、IL-1β和IL-6产生。CGI1746有效抑制固定化或可溶性的免疫复合物刺激的人单核细胞中TNFα和IL-1β的产生, 并较小程度地抑制IL-6(高出3倍或8倍的IC50)产生。				
体内研究	CGI1746废除B细胞依赖性关节炎。CGI174治疗(100毫克/千克, 皮下注射, 一天两次)导致整体临床关节炎被显著抑制(97%)。在阳性抗胶原蛋白 II抗体诱导的关节炎(CAIA)模型中, CGI1746治疗大幅度降低TNFα、IL-1β、IL-6以及MCP1和MIP-1α的mRNA和蛋白质水平。在患有关节炎的小鼠和大鼠体内, CGI1746能够很好地阻断TNFα, 并显著减少其临床数量, 同时降低关节发炎。				
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	Lanthascreen测定在Km, ATP(10μM), 人全长Btk(C-端V5-His6在Sf9细胞中表达)中进行, 并通过EnVision量化。

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.Di Paolo JA, et al. Nat Chem Biol. 2011, 7(1):41-50.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1184-10mM	CGI-1746 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1184-5mg	CGI-1746 (BTK抑制剂)	5mg
SC1184-25mg	CGI-1746 (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:**

- 本产品有腐蚀性，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或腐蚀其他物品。
- 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