

Siponimod (BAF-312)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Siponimod (BAF-312)	53249ES08	5 mg
	53249ES10	10 mg
	53249ES25	25 mg

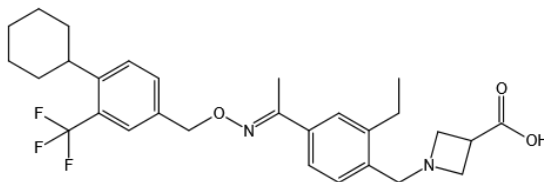
产品描述

Siponimod (BAF-312, BAF312), 又称辛波莫德, 是新一代、可口服的、有效鞘氨醇-1-磷酸(S1P)受体选择性激动剂, 作用于 S1P1/5 受体, EC_{50} 分别为 0.39 nM 和 0.98 nM, 比对 S1P2/3/4 受体选择性高 1000 倍以上。BAF312 显著降低继发进展性多发性硬化症残疾风险。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Siponimod, BAF-312, BAF312
中文名称 (Chinese Name)	辛波莫德
靶点 (Target)	S1P1 和 S1P5 受体
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--LPL Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	1230487-00-9
分子式 (Formula)	$C_{29}H_{35}F_3N_2O_3$
分子量 (Molecular Weight)	516.60
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO 和无水乙醇

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

（一）细胞实验（体外实验）

BAF312 (1 μ M)促进 91% S1P1 受体的显著内化。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在大鼠实验性自身免疫性脑脊髓炎模型中，每日口服 0.3 或 3 mg/kg 的 BAF312，显著降低大鼠疾病评分。健康受试者服用 BAF312 (0.3-20 mg/d)后，人体外周血中的淋巴细胞数剂量依赖性减少。^[1] 在实验性自身免疫性脑脊髓炎小鼠模型中，口服 0.3 mg/kg 的 BAF312 预防性或治疗性给药时，显著降低临床评分，淋巴细胞水平和单核细胞水平。^[3]

参考文献

- [1]. Gergely P, et al. The selective sphingosine 1-phosphate receptor modulator BAF312 redirects lymphocyte distribution and has species-specific effects on heart rate. *Br J Pharmacol.* 2012 Nov;167(5):1035-47.
- [2]. Pan S, et al. Discovery of a Brain-Penetrant S1P3-Sparing Direct Agonist of the S1P1 and S1P5 Receptors Efficacious at Low Oral Dose. *J Med Chem.* 2011 Oct 13;54(19):6724-33.
- [3]. Lewis ND, et al. Circulating monocytes are reduced by sphingosine-1-phosphate receptor modulators independently of S1P3. *J Immunol.* 2013, 190(7), 3533-3540.