



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

产品名称: **TG4-155**
CAS 号: **1164462-05-8**
产品货号: **S87629**

生物活性:						
Description	TG4-155 是一种有效的脑渗透性的选择性 EP2 受体拮抗剂, Ki 为 9.9 nM。TG4-155 只对 EP2 和 DP1 具有低纳摩尔的拮抗活性。TG4-155 作用于 EP2 的 KB 为 2.4 nM, 比对 DP1 受体的选择性高 14 倍, 比对 EP1, EP3, EP4 和 IP 的选择性比高 550-4750 倍。					
	TG4-155 inhibits the serotonin 5-HT2B receptor with IC50=2.6 μM and hERG (human Ether-à-go-go-Related Gene) with IC50=12 μM[1]. PGE2 (0.1-10 μM) stimulation significantly enhances human prostate cancer cell line PC3 cell growth in a concentration-dependent manner with a maximal response being obtained at approximately 1 μM. This PGE2-induced cancer cell proliferation is significantly suppressed by TG4-155 (0.01-1 μM ; 48 hours) in a concentration-dependent manner[1]. Cell Viability Assay[1]					
In Vitro	Cell Line:	PC3 cells				
	Concentration:	48 hours				
	Incubation Time:	0.01, 0.1, and 1 μM				
	Result:	Significantly suppressed PGE2-induced cancer cell proliferation in a concentration-dependent manner.				
In Vivo	Administration of TG4-155 (5 mg/kg, i.p.; at 1 and 12 h) significantly reduces status epilepticus (SE)-induced neurodegeneration scores in C57BL/6 mice[3]. TG4-155 (3 mg/kg; i.p.) displays a bioavailability of 61% (i.p. route compared with i.v.), a plasma half-life (t1/2) of 0.6 h, and a brain/plasma ratio of 0.3 in C57BL/6 mice[3].					
	Animal Model:	C57BL/6 mice (8-12 wk old)[3]				
	Dosage:	5 mg/kg				
	Administration:	I.p.; at 1 and 12 h				
	Result:	Administration significantly reduced SE-induced neurodegeneration scores by 91% in hippocampal subregions CA1, by 80% in CA3, and by 63% in hilus.				
	Animal Model:	C57BL/6 mice[3]				
	Dosage:	3 mg/kg				
	Administration:	I.p.				
	Result:	Displayed a bioavailability of 61% (i.p. route compared with i.v.), t1/2 of 0.6 h, and a brain/plasma ratio of 0.3.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (316.89 mM); 超声助溶; 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	1 mg	5 mg	10 mg
		Concentration				
		1 mM	2.5351 mL	12.6756 mL	25.3511 mL	
	5 mM	0.5070 mL	2.5351 mL	5.0702 mL		
	10 mM	0.2535 mL	1.2676 mL	2.5351 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.27 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.27 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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。
参考文献	[1]. Jiang J, et al. Role of prostaglandin receptor EP2 in the regulations of cancer cell proliferation, invasion, and inflammation. J Pharmacol Exp Ther. 2013 Feb;344(2):360-7. [2]. Ganesh T. Prostanoid receptor EP2 as a therapeutic target. J Med Chem. 2014 Jun 12;57(11):4454-65. [3]. Jiang J, et al. Small molecule antagonist reveals seizure-induced mediation of neuronal injury by prostaglandin E2 receptor subtype EP2. Proc Natl Acad Sci U S A. 2012 Feb 21;109(8):3149-54.

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	2.5351 mL	12.6756 mL	25.3511 mL	63.3778 mL
	5 mM	0.5070 mL	2.5351 mL	5.0702 mL	12.6756 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

	10 mM	0.2535 mL	1.2676 mL	2.5351 mL	6.3378 mL
	15 mM	0.1690 mL	0.8450 mL	1.6901 mL	4.2252 mL
	20 mM	0.1268 mL	0.6338 mL	1.2676 mL	3.1689 mL
	25 mM	0.1014 mL	0.5070 mL	1.0140 mL	2.5351 mL
	30 mM	0.0845 mL	0.4225 mL	0.8450 mL	2.1126 mL
	40 mM	0.0634 mL	0.3169 mL	0.6338 mL	1.5844 mL
	50 mM	0.0507 mL	0.2535 mL	0.5070 mL	1.2676 mL
	60 mM	0.0423 mL	0.2113 mL	0.4225 mL	1.0563 mL
	80 mM	0.0317 mL	0.1584 mL	0.3169 mL	0.7922 mL
	100 mM	0.0254 mL	0.1268 mL	0.2535 mL	0.6338 mL



源叶