



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: **Asapiprant**
CAS 号: **932372-01-5**
产品货号: **S87660**

生物活性:																		
Description	Asapiprant 是一个强效且有选择性的 DP1 受体拮抗剂, 其 Ki 值为 0.44 nM。																	
IC50 & Target[1]	DP1 0.44 nM (Ki)																	
In Vivo	Asapiprant 口服给予绵羊 (1 和 3 mg/kg) 可显著 (P<0.01) 抑制鼻阻力增加, 抑制率分别为 82% 和 92%。Asapiprant 口服给予绵羊 (5 mg/kg) 可抑制前列腺素 D2 (PGD2) 诱导的鼻阻力增加, 抑制率为 86%。Asapiprant 在抗原攻击前 1 小时口服给予猪 (3、10 和 30 mg/kg) 可分别抑制即时气道反应 (IAR) 52%、57% 和 96%, 以及晚期气道反应 (LAR) 67%、50% 和 79%。连续 4 天口服 Asapiprant (5 mg/kg) 可显著 (P<0.01) 抑制抗原诱导的绵羊鼻阻力增加, 抑制率为 73%。猪接受 Asapiprant (3 和 30 mg/kg) 治疗后鼻腔分泌物分别减少 53% 和 72% (P<0.01) 。Asapiprant 治疗大鼠 (10 mg/kg) 显著 (P<0.05) 降低气道高反应性 (AHR)、炎性细胞浸润和支气管肺泡灌洗液 (BALF) 中的粘蛋白生成, 而 Asapiprant (0.1 mg/kg) 未显示显著效果[1]。																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 11.11 mg/mL (22.15 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)																	
	<table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> SolventMassConcentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.9938 mL</td><td>9.9691 mL</td><td>19.9382 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.3988 mL</td><td>1.9938 mL</td><td>3.9876 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1994 mL</td><td>0.9969 mL</td><td>1.9938 mL</td></tr></table>	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	1.9938 mL	9.9691 mL	19.9382 mL	5 mM	0.3988 mL	1.9938 mL	3.9876 mL	10 mM	0.1994 mL	0.9969 mL	1.9938 mL
	Preparing Stock Solutions		SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg												
			1 mM	1.9938 mL	9.9691 mL	19.9382 mL												
			5 mM	0.3988 mL	1.9938 mL	3.9876 mL												
10 mM		0.1994 mL	0.9969 mL	1.9938 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°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。																		
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: ≥ 1.11 mg/mL (2.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.11 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 11.1 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 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。																		



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

	方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.11 mg/mL (2.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.11 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 11.1 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.11 mg/mL (2.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.11 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 11.1 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]. Takahashi G, et al. Effect of the potent and selective DP1 receptor antagonist, asapiprant (S-555739), in animal models of allergic rhinitis and allergic asthma. Eur J Pharmacol. 2015 Oct 15;765:15-23.
------	--

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	1.9938 mL	9.9691 mL	19.9382 mL	49.8455 mL
	5 mM	0.3988 mL	1.9938 mL	3.9876 mL	9.9691 mL
	10 mM	0.1994 mL	0.9969 mL	1.9938 mL	4.9845 mL
	15 mM	0.1329 mL	0.6646 mL	1.3292 mL	3.3230 mL
	20 mM	0.0997 mL	0.4985 mL	0.9969 mL	2.4923 mL