



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: shyysw@sina.com

产品名称: **CS-2758; BPTU ; BMS-646786**

CAS 号: **870544-59-5**

产品货号: **S87834**

生物活性:				
Description	BPTU (BMS-646786) 是一种非核苷酸类 P2Y1 受体变构拮抗剂, 具有抗血栓活性。BPTU 能够阻断位于胃肠道神经肌肉接头的 P2Y1 受体。			
IC50 & Target	P2Y1 Receptor			
In Vitro	BPTU 在大鼠和小鼠结肠中以浓度依赖性方式阻断超大快速抑制连接电位 (fIJP)。BPTU 对大鼠和小鼠结肠的 EC50 分别约为 0.3 μM 和 0.06 μM。在大鼠结肠中, 添加 10 μM 的 P2Y 激动剂 ADP β S 可显著降低自发性收缩至 $43.2 \pm 13.4\%$ (N=5) (P=0.0002), 并且这种降低通过与浓度为 3 微米 (93.3 $\pm$ 5.1%)。在小鼠结肠中获得了类似的结果, 其中 10 μM 的 ADP β S 将收缩曲线下面积 (AUC) 降低至 $15.8 \pm 5.1\%$ (N=4) (P<0.0001), 并且其效果被 3 μM 的 BPTU 逆转 ($82.7 \pm 3.6\%$)。添加浓度为 5 μM 的选择性 P2Y1 激动剂 MRS2365 可显著降低小鼠结肠中的自发收缩至 $21.2 \pm 4.8\%$ (N=5) (P=0.0002), 并且这种降低会被 15 分钟孵育阻断浓度为 3 μM (93.1 $\pm$ 3.8%) 的 BPTU。3 μM BPTU 对 MRS2365 诱导反应的阻断也发生在对照条件下 (N=5) ($10.2 \pm 5.5\%$ 对 $86.7 \pm 5.0\%$)[1]。			
In Vivo	从腹膜腔摄取 BPTU 的速度相对较快。血硼水平在给药后 1 小时内达到最大值。仅 1 小时后, 在色素性肿瘤中发现 BPTU 的硼肿瘤与血液比高于 1, 这表明药物滞留。这在非色素性肿瘤变体中是看不到的, 其中肿瘤硼水平与血液水平密切相关。长达 24 小时, 硼癸酸钠 (BSH) 在任一肿瘤中均未表现出选择性滞留, 但由于施用了更高量的硼, 因此达到了比 BPTU 更高的最大肿瘤硼浓度。在组织分布阶段, BSH 的肝肾硼浓度比范围为 2 至 4, 而 BPTU[2] 的范围为 0.5 至 1。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 33.3 mg/mL (74.76 mM); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown			
		Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.2450 mL	11.2251 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4490 mL	2.2450 mL
		10 mM	0.2245 mL	1.1225 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.61 mM); 澄清溶液			



	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.61 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Noemí Mañé, et al. BPTU, an allosteric antagonist of P2Y₁ receptor, blocks nerve mediated inhibitory neuromuscular responses in the gastrointestinal tract of rodents. Neuropharmacology. 2016 Nov;110(Pt A):376-385. [2]. Dandan Zhang, et al. Two disparate ligand binding sites in the human P2Y₁ receptor. Nature. 2015 Apr 16; 520(7547): 317 - 321.

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	2.2450 mL	11.2251 mL	22.4502 mL	56.1255 mL
	5 mM	0.4490 mL	2.2450 mL	4.4900 mL	11.2251 mL
	10 mM	0.2245 mL	1.1225 mL	2.2450 mL	5.6126 mL
	15 mM	0.1497 mL	0.7483 mL	1.4967 mL	3.7417 mL
	20 mM	0.1123 mL	0.5613 mL	1.1225 mL	2.8063 mL
	25 mM	0.0898 mL	0.4490 mL	0.8980 mL	2.2450 mL
	30 mM	0.0748 mL	0.3742 mL	0.7483 mL	1.8709 mL
	40 mM	0.0561 mL	0.2806 mL	0.5613 mL	1.4031 mL
	50 mM	0.0449 mL	0.2245 mL	0.4490 mL	1.1225 mL
	60 mM	0.0374 mL	0.1871 mL	0.3742 mL	0.9354 mL