



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: **RO1138452**
CAS 号: **221529-58-4**
产品货号: **S87842**

生物活性:

Description	RO1138452 是一种有效的选择性前列腺素 IP (prostacyclin) 受体拮抗剂。RO1138452 对 IP 受体具有高的亲和力。在人血小板中, pKi 值为 9.3 ± 0.1 ; 在重组 IP 受体系统中, pKi 值为 8.7 ± 0.06 。		
IC50 & Target[1]	Rat I ₂ Receptor 7 nM (IC ₅₀)	Rat I ₂ Receptor 8.33 (pKi)	Rabbit PAF Receptor 52.9 nM (IC ₅₀)
	Human α_{2A} adrenoceptor 724 nM (IC ₅₀)	Rat α_{1B} adrenoceptor 3280 nM (IC ₅₀)	Human Muscarinic M ₄ Receptor 1450 nM (IC ₅₀)
	Human muscarinic M ₂ Receptor 2220 nM (IC ₅₀)	Human muscarinic M ₁ Receptor 2570 nM (IC ₅₀)	Human muscarinic M ₅ Receptor 3110 nM (IC ₅₀)
	Rat 5-HT _{1B} Receptor 1130 nM (IC ₅₀)	pig 5-HT _{2C} Receptor 1190 nM (IC ₅₀)	Rat 5-HT _{2A} Receptor 3040 nM (IC ₅₀)
	Human 5-HT _{1A} Receptor 8580 nM (IC ₅₀)	Guinea-pig 5-HT ₄ Receptor 8910 nM (IC ₅₀)	Rat α_{1B} adrenoceptor 5.87 (pKi)
		Human muscarinic M ₁ Receptor 6.49 (pKi)	Human muscarinic M ₅ Receptor 5.81 (pKi)
	Human α_{2A} adrenoceptor 6.49 (pKi)	Receptor 5.66 (pKi)	
	Human muscarinic M ₂ Receptor 5.88 (pKi)	Human muscarinic M ₄ Receptor 6.14 (pKi)	Rabbit PAF Receptor 7.9 (pKi)
	Guinea-pig 5-HT ₄ Receptor 5.35 (pKi)	Human 5-HT _{1A} Receptor 5.37 (pKi)	Rat 5-HT _{2A} Receptor 5.71 (pKi)
	Rat 5-HT _{1B} Receptor 6.11 (pKi)	Pig 5-HT _{2C} Receptor 6.11 (pKi)	
In Vitro	RO1138452 是腹腔注射; 受体拮抗剂。RO1138452 抑制 cAMP 积累的 pIC ₅₀ 值为 7.0 ± 0.07 。通过测量稳定表达人腹腔注射; 受体的 CHO-K1 细胞中卡前列环素诱导的 cAMP 积累的抑制作用, 研究 RO1138452 的功能性拮抗作用。RO1138452 的拮抗剂亲和力 (pKi) 为 9.0 ± 0.06 。RO1138452 的选择性分布是通过一组受体结合和酶测定确定的。RO1138452 对咪唑啉 2 (I ₂) (8.3) 和血小板活化因子 (PAF) (7.9) 受体具有亲和力[1]。RO1138452 (10 pM-10 μ M) 与固定浓度的 Taprostene (1 μ M) 同时添加到细胞中, 以浓度依赖性方式抑制 CXCL9 和 CXCL10 的释放, p[A] ₅₀ (摩尔) 值分别为 -8.73 ± 0.11 和 -8.47 ± 0.16 ($p > 0.05$)[2]。		
In Vivo	RO1138452 是一种有效的选择性人和大鼠腹腔注射; 受体拮抗剂, 具有镇痛和抗炎作用。RO1138452 (1-10 mg/kg, iv) 显著减少乙酸引起的腹部收缩。RO1138452 (3-100 mg/kg, po) 显著减少 Carrageenan (HY-125474) 诱导的机械痛觉过敏和水肿形成。RO1138452 (5 mg/kg, iv) 给药大鼠一小时后, 总血浆浓度为 0.189 μ g/mL, 而游离血浆浓度计算为 0.009 μ g/mL (28 nM)[1]。		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (323.20 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) Ethanol 中的溶解度 : 50 mg/mL (161.60 mM; 超声助溶)		



Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	3.2320 mL	16.1598 mL	32.3196 mL
	5 mM	0.6464 mL	3.2320 mL	6.4639 mL
	10 mM	0.3232 mL	1.6160 mL	3.2320 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 → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 5 mg/mL (16.16 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 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 μ L 50.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中,混合均匀。

方案 二

请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.08 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中,混合均匀;再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80,混合均匀;然后再继续加入 450 μ L 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 三

请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (8.08 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液,悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。

以下溶解方案,请直接配制工作液。建议现用现配,在短期内尽快用完。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



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

	请依序添加每种溶剂: 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 10 mg/mL (32.32 mM); 澄清溶液; 超声助溶
参考文献	[1]. Bley KR, et al. RO1138452 and RO3244794: characterization of structurally distinct, potent and selective IP (prostacyclin) receptor antagonists. Br J Pharmacol. 2006 Feb;147(3):335-45. [2]. Ayer LM, et al. 4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl)-[4-(4-isopropoxy-benzyl)-phenyl]-amine (RO1138452) is a selective, pseudo-irreversible orthosteric antagonist at the prostacyclin (IP)-receptor expressed by human airway epithelial cells: IP-receptor-mediated inhibition of CXCL9 and CXCL10 release. J Pharmacol Exp Ther. 2008 Feb;324(2):815-26.

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
Ethanol / DMSO	1 mM	3.2320 mL	16.1598 mL	32.3196 mL	80.7989 mL
	5 mM	0.6464 mL	3.2320 mL	6.4639 mL	16.1598 mL
	10 mM	0.3232 mL	1.6160 mL	3.2320 mL	8.0799 mL
	15 mM	0.2155 mL	1.0773 mL	2.1546 mL	5.3866 mL
	20 mM	0.1616 mL	0.8080 mL	1.6160 mL	4.0399 mL
	25 mM	0.1293 mL	0.6464 mL	1.2928 mL	3.2320 mL
	30 mM	0.1077 mL	0.5387 mL	1.0773 mL	2.6933 mL
	40 mM	0.0808 mL	0.4040 mL	0.8080 mL	2.0200 mL
	50 mM	0.0646 mL	0.3232 mL	0.6464 mL	1.6160 mL
	60 mM	0.0539 mL	0.2693 mL	0.5387 mL	1.3466 mL
	80 mM	0.0404 mL	0.2020 mL	0.4040 mL	1.0100 mL
	100 mM	0.0323 mL	0.1616 mL	0.3232 mL	0.8080 mL