



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: **ASP-7663**
CAS 号: **1190217-35-6**
产品货号: **S87940**

生物活性:

Description	ASP7663 是具有口服活性的、选择性的 TRPA1 激动剂。ASP7663 具有抗便秘和抗腹痛的活性。				
In Vitro	ASP7663 concentration dependently increases intracellular Ca2+ concentration in human, rat, and mouse TRPA1 expressed in HEK293 cells in a similar manner, with respective EC50 values (95% confidence interval [CI]) of 0.51 (0.40 - 0.66), 0.54 (0.41 - 0.72), and 0.50 (0.41 - 0.63) μmol/L[1]. ASP7663 concentration-dependently stimulates 5-HT release from QGP-1 cells, a lineage of TRPA1-expressing EC cells, with an EC50 value of 72.5 (52.6 - 99.9) μmol/L[1]。				
In Vivo	ASP7663 significantly improves the loperamide-induced delay in colonic transit in mice[1]. ASP7663 (orally, 0.3 and 1 mg/kg) significantly shortens the prolonged bead expulsion time caused by loperamide[1]. ASP7663 (orally, 1 and 3 mg/kg) exhibits inhibitory effects on colorectal distension in rat[1]。				
	Animal Model:	CRD model (colorectal distension in rat)[1].			
	Dosage:	1 and 3 mg/kg.			
	Administration:	Orally.			
	Result:	Significantly reduced the number of abdominal contractions evoked during CRD at pressures of 30, 45, and 60 mmHg. ASP7663 also reduced the number of abdominal contractions by intravenous treatment.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (189.93 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 / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.7985 mL	18.9926 mL	37.9853 mL
		5 mM	0.7597 mL	3.7985 mL	7.5971 mL
	10 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7985 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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 (7.90 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。					



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

	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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (7.90 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 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。
参考文献	[1]. Ryosuke Kojima, et al. Effects of Novel TRPA1 Receptor Agonist ASP7663 in Models of Drug-Induced Constipation and Visceral Pain. Eur J Pharmacol. 2014 Jan 15;723:288-93. [2]. Yao Lu, et al. Transient Receptor Potential Ankyrin 1 Activation Within the Cardiac Myocyte Limits Ischemia-reperfusion Injury in Rodents. Anesthesiology. 2016 Dec;125(6):1171-1180.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.7985 mL	18.9926 mL	37.9853 mL	94.9632 mL
	5 mM	0.7597 mL	3.7985 mL	7.5971 mL	18.9926 mL
	10 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7985 mL	9.4963 mL
	15 mM	0.2532 mL	1.2662 mL	2.5324 mL	6.3309 mL
	20 mM	0.1899 mL	0.9496 mL	1.8993 mL	4.7482 mL
	25 mM	0.1519 mL	0.7597 mL	1.5194 mL	3.7985 mL
	30 mM	0.1266 mL	0.6331 mL	1.2662 mL	3.1654 mL
	40 mM	0.0950 mL	0.4748 mL	0.9496 mL	2.3741 mL
	50 mM	0.0760 mL	0.3799 mL	0.7597 mL	1.8993 mL
	60 mM	0.0633 mL	0.3165 mL	0.6331 mL	1.5827 mL
	80 mM	0.0475 mL	0.2374 mL	0.4748 mL	1.1870 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

	100 mM	0.0380 mL	0.1899 mL	0.3799 mL	0.9496 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶