



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: **RO-4926219; Gefapixant**

CAS 号: **1015787-98-0**

产品货号: **S88251**

生物活性:

Description	Gefapixant 是一种口服有效的 P2X3 受体 (P2X3R) 拮抗剂, 其对人同源重组 hP2X3 和 hP2X2/3 的 IC50 值分别是 ~30 nM 和 100-250 nM。Gefapixant 可用于慢性咳嗽与膝关节关节炎的研究。				
IC50 & Target	P2X3 Receptor				
In Vitro	Gefapixant 对任何不含 P2X3 亚基的受体均未显示出抑制作用 (在重组同源三聚体 hP2X1、hP2X2、hP2X4、rP2X5 和 hP2X7 通道中 IC50 值 >10,000 nM)[1]。				
In Vivo	在膝关节骨关节炎大鼠模型中 (关节内注射碘乙酸 14 天后), Gefapixant (7 天, 每天两次, 口服) 在两个较高剂量下减轻了负重侧化, 并完全逆转了明显的痛觉过敏[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 :29.17 mg/mL (82.54 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	2.8297 mL	14.1483 mL	28.2965 mL
		5 mM	0.5659 mL	2.8297 mL	5.6593 mL
		10 mM	0.2830 mL	1.4148 mL	2.8297 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% PBS Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.07 mM); 澄清溶液					
方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.89 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 ddH ₂ O 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.89 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 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 四 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.89 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]. Anthony P. Ford, et al. The therapeutic promise of ATP antagonism at P2X3 receptors in respiratory and urological disorders. Front Cell Neurosci. 2013; 7: 267. [2]. Ford AP, In pursuit of P2X3 antagonists: novel therapeutics for chronic pain and afferent sensitization. Purinergic Signal. 2012 Feb;8(Suppl 1):3-26. [3]. Martin Nguyen A, et al. Validation of a visual analog scale for assessing cough severity in patients with chronic cough. Ther Adv Respir Dis. 2021 Jan-Dec;15:17534666211049743.

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	2.8297 mL	14.1483 mL	28.2965 mL	70.7414 mL
	5 mM	0.5659 mL	2.8297 mL	5.6593 mL	14.1483 mL
	10 mM	0.2830 mL	1.4148 mL	2.8297 mL	7.0741 mL
	15 mM	0.1886 mL	0.9432 mL	1.8864 mL	4.7161 mL
	20 mM	0.1415 mL	0.7074 mL	1.4148 mL	3.5371 mL
	25 mM	0.1132 mL	0.5659 mL	1.1319 mL	2.8297 mL
	30 mM	0.0943 mL	0.4716 mL	0.9432 mL	2.3580 mL
	40 mM	0.0707 mL	0.3537 mL	0.7074 mL	1.7685 mL
	50 mM	0.0566 mL	0.2830 mL	0.5659 mL	1.4148 mL
	60 mM	0.0472 mL	0.2358 mL	0.4716 mL	1.1790 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: shyysw@sina.com

	80 mM	0.0354 mL	0.1769 mL	0.3537 mL	0.8843 mL
--	-------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶