



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: **AM-211**
CAS 号: **1175526-27-8**
产品货号: **S88283**

生物活性:

Description	AM211 是一种有效的, 选择性的, 可口服的前列腺素受体 (DP2) 拮抗剂, 对人, 小鼠, 豚鼠和大鼠的 DP2 的 IC50 值分别为 4.9 nM, 7.8 nM, 4.9 nM, 10.4 nM。				
IC50 & Target	DP				
In Vitro	AM211 是一种有效、选择性和口服生物利用度了良好的前列腺素 D2 (PGD2) 受体 2 型 (DP2) 拮抗剂, 对人、小鼠、豚鼠和大鼠 DP2 的 IC50 值分别为 4.9 nM、7.8 nM、4.9 nM、10.4 nM。在 0.2% 血清白蛋白存在下, AM211 抑制放射性标记的 PGD2 与人、小鼠、豚鼠和大鼠 DP2 的结合, IC50 值分别为 12.2、20.1、22.9 和 34.2 nM。相对于前列腺素家族中的其他受体, AM211 对 DP2 表现出高选择性, 抑制放射性配体与人 TP、IP、DP1 和 FP 结合的 IC50 值超过 100 μM。AM211 (100 μM) 对 COX-1、COX-2 酶以及 PPAR 核受体家族没有活性[1]。				
In Vivo	AM211 (1、10 和 30 mg/kg, 口服) 以剂量依赖地方式降低 DK-PGD2 诱导的外周血白细胞数量, 其计算出的 ED50 值为 0.85 mg/kg。AM211 (30 mg/kg) 也能降低豚鼠中抗原诱导的肺部炎症。在过敏性鼻炎小鼠模型中, AM211 (10 mg/kg, 口服) 显著减少卵清蛋白 (OVA) 诱导的打喷嚏症状[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (249.75 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				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9980 mL	9.9898 mL	19.9796 mL
		5 mM	0.3996 mL	1.9980 mL	3.9959 mL
		10 mM	0.1998 mL	0.9990 mL	1.9980 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.16 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					



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: shyyysw@sina.com

	溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.16 mM); 悬浊液; 超声加热助溶 此方案可获得 2.08 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 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.16 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]. Bain G, et al. Pharmacology of AM211, a potent and selective prostaglandin D2 receptor type 2 antagonist that is active in animal models of allergic inflammation. J Pharmacol Exp Ther. 2011 Jul;338(1):290-301.

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	1.9980 mL	9.9898 mL	19.9796 mL	49.9491 mL
	5 mM	0.3996 mL	1.9980 mL	3.9959 mL	9.9898 mL
	10 mM	0.1998 mL	0.9990 mL	1.9980 mL	4.9949 mL
	15 mM	0.1332 mL	0.6660 mL	1.3320 mL	3.3299 mL
	20 mM	0.0999 mL	0.4995 mL	0.9990 mL	2.4975 mL
	25 mM	0.0799 mL	0.3996 mL	0.7992 mL	1.9980 mL
	30 mM	0.0666 mL	0.3330 mL	0.6660 mL	1.6650 mL
	40 mM	0.0499 mL	0.2497 mL	0.4995 mL	1.2487 mL
	50 mM	0.0400 mL	0.1998 mL	0.3996 mL	0.9990 mL
	60 mM	0.0333 mL	0.1665 mL	0.3330 mL	0.8325 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	0.0250 mL	0.1249 mL	0.2497 mL	0.6244 mL
	100 mM	0.0200 mL	0.0999 mL	0.1998 mL	0.4995 mL



源叶