



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: **ABT 702 Dihydrochloride**

CAS 号: **1188890-28-9**

产品货号: **S88287**

生物活性:				
Description	ABT-702 dihydrochloride 是一种有效的腺苷激酶 (AK) 抑制剂 (IC ₅₀ =1.7 nM)。			
IC₅₀ & Target	IC ₅₀ : 1.7 nM (Adenosine kinase, AK)[1]			
In Vitro	ABT-702 是一种口服有效的腺苷激酶 (AK) 抑制剂, 它与其他腺苷 (ADO) 相互作用位点 (如 A1、A2A、A3 受体、ADO 转运蛋白和 ADO 脱氨酶) 的选择性高出几个数量级。ABT-702 对抑制天然人 AK (胎盘来源)、两种人重组异构体 (AKlong 和 AKshort) 以及来自猴、狗、大鼠和小鼠脑部的 AK 具有相同效力 (IC ₅₀ =1.5±0.3 nM)。ABT-702 以浓度依赖的方式强力抑制大鼠脑胞质 AK 的活性, 其 IC ₅₀ 值为 1.7 nM。ABT-702 还能强力抑制完整培养的人神经母细胞瘤 IMR-32 细胞内的 AK 活性 (IC ₅₀ =51 nM), 这表明 ABT-702 能够穿透细胞膜并在细胞内有效位点强力抑制 AK[1]。			
In Vivo	ABT-702 在小鼠热板测试中, 无论是腹腔注射 (ED₅₀=8 μmol/kg i.p.) 还是口服给药 (ED₅₀=65 μmol/kg p.o.) 均能以剂量依赖的方式显著降低急性热痛觉过敏。与在热板试验中的镇痛效果一致, ABT-702 在腹部收缩试验中也表现出剂量依赖性的镇痛效果 (ED₅₀=2 μmol/kg i.p.)。ABT-702 在这种持续化学疼痛模型中显示出完全的有效性[1]。 在静脉注射 2-18F-氟脱氧-D-葡萄糖 (FDG) 前 10 分钟, 大鼠被给予腹腔注射腺苷 A1 受体拮抗剂 DPCPX (3 mg/kg)、ABT-702 (3 mg/kg) 或溶媒对照 (每只大鼠 15.4±0.7 MBq FDG)。随后对这些大鼠进行 15 分钟的静态正电子发射断层扫描 (PET)。重建图像被标准化到大鼠 FDG PET 模板, 并计算出标准摄取值 (SUVs)。为了比较活性治疗与溶媒对照之间的区域效应, 进行了统计参数映射分析。全脑 FDG 摄取不受药物治疗的影响。与溶媒对照组相比, DPCPX 和 ABT-702 处理的大鼠在特定区域, 特别是小脑中检测到显著的低代谢现象。因此, 尽管在静息状态下的大鼠中这种影响是温和的, 但内源性腺苷可以影响 FDG 的累积。三组间体重 (316.8±28.4 g; 平均值±标准差) 和血糖 (5.5±1.7 mM) 没有显著差异。全脑 PET SUV 值分别为: 溶媒对照组 1.6±0.4, ABT-702 处理组 1.6±0.6, DPCPX 处理组 1.8±0.6 (F(2,9)=0.298, P=0.75)。统计参数映射 (SPM) 分析显示, 与溶媒对照组相比, ABT-702 处理组的大鼠在小脑、中脑区域和延髓中存在显著的区域性低代谢[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 33.33 mg/mL (62.15 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
		1 mM	1.8648 mL	9.3240 mL
		5 mM	0.3730 mL	1.8648 mL
		10 mM	0.1865 mL	0.9324 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 (sealed storage, away from moisture)。-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: ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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 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: ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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]. Jarvis MF, et al. ABT-702 (4-amino-5-(3-bromophenyl)-7-(6-morpholinopyridin-3-yl)pyrido[2, 3-d]pyrimidine), a novel orally effective adenosine kinase inhibitor with analgesic and anti-inflammatory properties: I. In vitro characterization and acute antinociceptive effects in the mouse. J Pharmacol Exp Ther. 2000 Dec;295(3):1156-64. [2]. Parkinson FE, et al. The Effect of Endogenous Adenosine on Neuronal Activity in Rats: An FDG PET Study. J Neuroimaging. 2016 Jul;26(4):403-5.

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, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8648 mL	9.3240 mL	18.6480 mL	46.6200 mL
	5 mM	0.3730 mL	1.8648 mL	3.7296 mL	9.3240 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

	10 mM	0.1865 mL	0.9324 mL	1.8648 mL	4.6620 mL
	15 mM	0.1243 mL	0.6216 mL	1.2432 mL	3.1080 mL
	20 mM	0.0932 mL	0.4662 mL	0.9324 mL	2.3310 mL
	25 mM	0.0746 mL	0.3730 mL	0.7459 mL	1.8648 mL
	30 mM	0.0622 mL	0.3108 mL	0.6216 mL	1.5540 mL
	40 mM	0.0466 mL	0.2331 mL	0.4662 mL	1.1655 mL
	50 mM	0.0373 mL	0.1865 mL	0.3730 mL	0.9324 mL
	60 mM	0.0311 mL	0.1554 mL	0.3108 mL	0.7770 mL



源叶