



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: **CS-2742**
CAS 号: **1286279-29-5**
产品货号: **S88342**

生物活性:

Description	BMS-813160 是有效的、选择性的 CCR2/5 的双拮抗剂。BMS-813160 与 CCR2 和 CCR5 结合, IC50 分别为 6.2 和 3.6 nM。BMS-813160 可用于炎症的研究。				
IC50 & Target[1]	CCR5 3.6 nM (IC ₅₀)	CCR2 6.2 nM (IC ₅₀)			
In Vitro	BMS-813160 binds with CCR2, CCR5, CCR1, CCR4 and CXCR2 with IC50s of 6.2 nM, 3.6 nM, >25 μ M, >40 μ M and >40 μ M, respectively[2]. BMS-813160 shows activities to CCR2 CTX, CCR2 CD11b, CCR5 CTX and CCR5 CD11b with IC50s of 0.8, 4.8, 1.1 and 5.7 nM, respectively[2]。				
In Vivo	BMS-813160 (10-160 mg/kg; p.o. twice a day for two days) inhibits the migration of inflammatory monocytes and macrophages in mouse thioglycollate-induced peritonitis model, and shows excellent oral bioavailability[2].				
	Animal Model:	Human-CCR2 knock-in C57BL/6 male mice with thioglycollate injection[2]			
	Dosage:	10, 50 and 160 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; 10-160 mg/kg twice a day; for two days			
	Result:	Dose-dependently reduced inflammatory monocyte and macrophage infiltration in the peritoneum.			
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : 100 mg/mL (206.34 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (51.58 mM; 超声加热助溶; 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	2.0634 mL	10.3169 mL	20.6339 mL
		5 mM	0.4127 mL	2.0634 mL	4.1268 mL
		10 mM	0.2063 mL	1.0317 mL	2.0634 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 (protect from light)。-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 (4.29 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 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.29 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.29 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]. Norman P. et al. A dual CCR2/CCR5 chemokine antagonist, BMS-813160? Evaluation of WO2011046916. Expert Opin Ther Pat. 2011 Dec;21(12):1919-24. [2]. Cherney RJ, et al. BMS-813160: A Potent CCR2 and CCR5 Dual Antagonist Selected as a Clinical Candidate. ACS Med Chem Lett. 2021 Oct 15;12(11):1753-1758.

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 (protect from light). -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 / Ethanol	1 mM	2.0634 mL	10.3169 mL	20.6339 mL	51.5847 mL
	5 mM	0.4127 mL	2.0634 mL	4.1268 mL	10.3169 mL
	10 mM	0.2063 mL	1.0317 mL	2.0634 mL	5.1585 mL
	15 mM	0.1376 mL	0.6878 mL	1.3756 mL	3.4390 mL
	20 mM	0.1032 mL	0.5158 mL	1.0317 mL	2.5792 mL
	25 mM	0.0825 mL	0.4127 mL	0.8254 mL	2.0634 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

	30 mM	0.0688 mL	0.3439 mL	0.6878 mL	1.7195 mL
	40 mM	0.0516 mL	0.2579 mL	0.5158 mL	1.2896 mL
	50 mM	0.0413 mL	0.2063 mL	0.4127 mL	1.0317 mL
Ethanol	60 mM	0.0344 mL	0.1719 mL	0.3439 mL	0.8597 mL
	80 mM	0.0258 mL	0.1290 mL	0.2579 mL	0.6448 mL
	100 mM	0.0206 mL	0.1032 mL	0.2063 mL	0.5158 mL



源叶