



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

产品名称: **AMG-333**
CAS 号: **1416799-28-4**
产品货号: **S88389**

生物活性:

Description	AMG 333 是一种具有口服活性的高选择性的 TRPM8 拮抗剂, IC50 为 13 nM。				
IC50 & Target	IC50: 13 nM (TRPM8)[1]				
In Vitro	AMG 333 (0.6-3 mg/kg, 口服灌胃, 单次给药) 在 Icilin (HY-11062) 诱导的湿犬样行为 Sprague-Dawley 大鼠模型中, 剂量依赖性地抑制湿犬样行为, 证明 AMG 333 有效阻断 TRPM8 靶点[1]。				
	AMG 333 (1-3 mg/kg, 口服灌胃, 单次给药) 在冷刺激诱导的血压升高 Sprague-Dawley 大鼠模型中, 剂量依赖性地阻断血压升高反应, 表明 AMG 333 有效作用于 TRPM8 靶点[1].				
	Animal Model:	Icilin (HY-11062)-induced wet-dog shake (WDS) behavior in Sprague-Dawley rat model[1]			
	Dosage:	0.6, 1, 3 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage (p.o.), single dose			
	Result:	Demonstrated significant dose-dependent inhibition; 3 mg/kg fully inhibited WDS.			
	Animal Model:	Cold stimulation-induced blood pressure elevation Sprague-Dawley rat model[1]			
	Dosage:	1, 3 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage (p.o.), single dose			
	Result:	Showed significant inhibition of cold-induced blood pressure elevation at 1 mg/kg and 3 mg/kg; 3 mg/kg fully blocked cold-pressor response.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (275.74 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	2.2059 mL	11.0297 mL	22.0595 mL
		5 mM	0.4412 mL	2.2059 mL	4.4119 mL
		10 mM	0.2206 mL	1.1030 mL	2.2059 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					



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

	方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (4.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 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 21.7 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]. Horne DB, et al. Discovery of TRPM8 Antagonist (S)-6-(((3-Fluoro-4-(trifluoromethoxy)phenyl)(3-fluoropyridin-2-yl)methyl)carbamoyl)nicotinic Acid (AMG 333), a Clinical Candidate for the Treatment of Migraine. J Med Chem. 2018 Sep 27;61(18):8186-8201.

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	2.2059 mL	11.0297 mL	22.0595 mL	55.1487 mL
	5 mM	0.4412 mL	2.2059 mL	4.4119 mL	11.0297 mL
	10 mM	0.2206 mL	1.1030 mL	2.2059 mL	5.5149 mL
	15 mM	0.1471 mL	0.7353 mL	1.4706 mL	3.6766 mL
	20 mM	0.1103 mL	0.5515 mL	1.1030 mL	2.7574 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

	25 mM	0.0882 mL	0.4412 mL	0.8824 mL	2.2059 mL
	30 mM	0.0735 mL	0.3677 mL	0.7353 mL	1.8383 mL
	40 mM	0.0551 mL	0.2757 mL	0.5515 mL	1.3787 mL
	50 mM	0.0441 mL	0.2206 mL	0.4412 mL	1.1030 mL
	60 mM	0.0368 mL	0.1838 mL	0.3677 mL	0.9191 mL
	80 mM	0.0276 mL	0.1379 mL	0.2757 mL	0.6894 mL
	100 mM	0.0221 mL	0.1103 mL	0.2206 mL	0.5515 mL



源叶