



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: **Etrumadenant (AB928)**

CAS 号: **2239273-34-6**

产品货号: **S88609**

生物活性:				
Description	Etrumadenant (AB928) 是一种具有口服活性、选择性的腺苷受体 (A2aR/A2bR) 双拮抗剂。Etrumadenant 减轻腺苷介导的免疫抑制。Etrumadenant 具有免疫调节和抗肿瘤活性。			
IC50 & Target	A2aR/A2bR[1]			
In Vitro	在人类体外细胞培养中, 在腺苷存在下分化的单核细胞来源树突状细胞 (moDC) 在混合淋巴细胞反应 (MLR) 中刺激同种异体 CD4+ T 细胞分泌 IFN- γ 的能力下降。该抑制作用可被 Etrumadenant 明显逆转。基于 NanoString 的多重基因表达谱分析发现, 在 moDC 分化过程中, 有 39 个基因受腺苷调控。Etrumadenant 可逆转这些基因表达的变化[2]。			
In Vivo	Etrumadenant 联合化疗在 AT3-OVA 肿瘤小鼠模型中可显著降低肿瘤体积; 与 NSC 266046 联合使用也表现出类似效果。AB928 (即 Etrumadenant) 同样可单药使用或与 α -PD-1 联合使用时抑制 B16-F10 肿瘤的生长。Etrumadenant 可增强抗肿瘤免疫反应, 从而抑制肿瘤生长, 并促进同系小鼠肿瘤模型中免疫细胞的浸润[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (586.21 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
		1 mM	2.3448 mL	11.7242 mL
		5 mM	0.4690 mL	2.3448 mL
		10 mM	0.2345 mL	1.1724 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.88 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.88 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.88 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]. Seitz L, et al. Safety, tolerability, and pharmacology of AB928, a novel dual adenosine receptor antagonist, in a randomized, phase 1 study in healthy volunteers. Invest New Drugs. 2019 Aug;37(4):711-721. [2]. Daniel DiRenzo, et al. AB928, a dual antagonist of the A2aR and A2bR adenosine receptors, relieves adenosine-mediated immune suppression [abstract].

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	2.3448 mL	11.7242 mL	23.4483 mL	58.6208 mL
	5 mM	0.4690 mL	2.3448 mL	4.6897 mL	11.7242 mL
	10 mM	0.2345 mL	1.1724 mL	2.3448 mL	5.8621 mL
	15 mM	0.1563 mL	0.7816 mL	1.5632 mL	3.9081 mL
	20 mM	0.1172 mL	0.5862 mL	1.1724 mL	2.9310 mL
	25 mM	0.0938 mL	0.4690 mL	0.9379 mL	2.3448 mL
	30 mM	0.0782 mL	0.3908 mL	0.7816 mL	1.9540 mL
	40 mM	0.0586 mL	0.2931 mL	0.5862 mL	1.4655 mL
	50 mM	0.0469 mL	0.2345 mL	0.4690 mL	1.1724 mL
	60 mM	0.0391 mL	0.1954 mL	0.3908 mL	0.9770 mL
	80 mM	0.0293 mL	0.1466 mL	0.2931 mL	0.7328 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

	100 mM	0.0234 mL	0.1172 mL	0.2345 mL	0.5862 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶