



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: **Abediterol; Cenerimod ; ACT-334441**

CAS 号: **1262414-04-9**

产品货号: **S88829**

生物活性:

Description	Cenerimod (ACT-334441) 是一种有效, 选择性和具有口服活性的 S1P1 受体调节剂, EC50 值为 1 nM。Cenerimod 对 hS1P1 的选择性比 hS1P2, hS1P3, hS1P4 和 hS1P5 受体亚型 (EC50s=>10000, 228, 2134 和 36 nM) 高出 36 倍以上。Cenerimod 可减轻鼠类实验性自身免疫性脑脊髓炎 (EAE)和鼠类硬皮病。				
IC50 & Target[1]	S1PR1 1 nM (EC50)	S1PR5 36 nM (EC50)	S1PR5 228 nM (EC50)	S1PR4 2134 nM (EC50)	
In Vitro	Cenerimod 是一种高效的 S1P1 受体激动剂, 在 (35S)-GTP γ S 测定中使用 HUVEC 细胞膜制剂, EC50 为 2 nM[1]。 Cenerimod 激活 G 蛋白并增加 CHO 细胞中的 Ca2+ 信号, EC50 分别为 1 nM 和 124 nM[1]。 Cenerimod (5 μ M; 24 h) 抑制成纤维细胞中的胶原蛋白生成[2]。				
In Vivo	Cenerimod (0.1-10 mg/kg; 单次口服) 在大鼠体内以剂量依赖性方式可逆地减少循环淋巴细胞的数量[1]。 Cenerimod (6 mg/kg/天, 持续 30 天; po) 在小鼠实验性自身免疫性脑炎 (EAE) 模型中减轻疾病 [1]。 Cenerimod (10 mg/kg/天, 持续 42 天; po) 减轻皮肤和 Scl-cGVHD 小鼠的肺纤维化[2]。				
	Animal Model:	Male Wistar rats weighing 294-510 g[1]			
	Dosage:	0.1, 0.3, 1, 3 and 10 mg/kg			
	Administration:	A single p.o.			
	Result:	Effectively and reversibly reduced the blood lymphocyte counts, with a plateau reached after a single oral dose of 1 mg/kg.			
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (220.49 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 Concentration Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2049 mL	11.0246 mL	22.0493 mL
		5 mM	0.4410 mL	2.2049 mL	4.4099 mL
		10 mM	0.2205 mL	1.1025 mL	2.2049 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。-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 (5.51 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.51 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]. Piali L, et, al. Cenerimod, a novel selective S1P 1 receptor modulator with unique signaling properties. Pharmacol Res Perspect. 2017 Dec;5(6):e00370. [2]. Kano M, et, al. Attenuation of murine sclerodermatous models by the selective S1P 1 receptor modulator cenerimod. Sci Rep. 2019 Jan 24;9(1):658.

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。 -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	2.2049 mL	11.0246 mL	22.0493 mL	55.1231 mL
	5 mM	0.4410 mL	2.2049 mL	4.4099 mL	11.0246 mL
	10 mM	0.2205 mL	1.1025 mL	2.2049 mL	5.5123 mL
	15 mM	0.1470 mL	0.7350 mL	1.4700 mL	3.6749 mL
	20 mM	0.1102 mL	0.5512 mL	1.1025 mL	2.7562 mL
	25 mM	0.0882 mL	0.4410 mL	0.8820 mL	2.2049 mL
	30 mM	0.0735 mL	0.3675 mL	0.7350 mL	1.8374 mL
	40 mM	0.0551 mL	0.2756 mL	0.5512 mL	1.3781 mL
	50 mM	0.0441 mL	0.2205 mL	0.4410 mL	1.1025 mL
	60 mM	0.0367 mL	0.1837 mL	0.3675 mL	0.9187 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	0.0276 mL	0.1378 mL	0.2756 mL	0.6890 mL
	100 mM	0.0220 mL	0.1102 mL	0.2205 mL	0.5512 mL



源叶