



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: 4-[(4-甲基苯基)硫基]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-甲酰胺; A-205804
CAS 号: 251992-66-2
产品货号: S89117

生物活性:

Description	A-205804 是抑制 E-selectin 和 ICAM-1 表达的口服有效的, 高效、选择性的先导抑制剂, 对 E-selectin 和 ICAM-1 作用的 IC50 分别为 20 nM 和 25 nM。A-205804 可用于慢性炎症疾病的研究。				
IC50 & Target	IC50: 20 nM (E-selectin), 25 nM (ICAM-1)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HUVEC	IC50	152 μM	Toxicity in HUVEC cell lysates	
	HUVEC	IC50	152 μM	In vitro cellular toxicity against human umbilical vein endothelial cells (HUVEC) in MTS assay	
In Vitro	A-205804 exhibits Cellular Toxicities for HUVEC with an IC50 of 152 μM[1]. A-205804 is an effective inhibitor of cell-cell adhesion in an in vitro flow experiment, demonstrating relevance in a model physiological system[1]。				
In Vivo	A-205804 (5 mg/kg; p.o.) shows a half-life of 1 hour for rat[1]. A-205804 (10 mg/kg; p.o.; 3 times per week; for 2 weeks) attenuates the E-selectin expression on the endothelial vascular niche cells in mice[2].				
	Animal Model:		C57BL/6 mice[2]		
	Dosage:		10 mg/kg		
	Administration:		Oral administration, 3 times per week, for 2 weeks		
	Result:		Efficiently decreased the expression of E-selectin on the endothelial vascular niche cells		
	Animal Model:		Rat[1]		
	Dosage:		5 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)		
	Administration:		Oral administration		
	Result:		t _{1/2} = 1 hour		
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (332.89 mM); 超声助溶 (<60°C); 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	3.3289 mL	16.6445 mL	33.2889 mL
		5 mM	0.6658 mL	3.3289 mL	6.6578 mL
		10 mM	0.3329 mL	1.6644 mL	3.3289 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					



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

	请您现用现配，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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.92 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 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.92 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]. Stewart AO, et al. Discovery of inhibitors of cell adhesion molecule expression in human endothelial cells. 1. Selective inhibition of ICAM-1 and E-selectin expression. J Med Chem. 2001 Mar 15;44(6):988-1002. [2]. Morita K, et al. RUNX transcription factors potentially control E-selectin expression in the bone marrow vascular niche in mice. Blood Adv. 2018 Mar 13;2(5):509-515.

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	3.3289 mL	16.6445 mL	33.2889 mL	83.2224 mL
	5 mM	0.6658 mL	3.3289 mL	6.6578 mL	16.6445 mL
	10 mM	0.3329 mL	1.6644 mL	3.3289 mL	8.3222 mL
	15 mM	0.2219 mL	1.1096 mL	2.2193 mL	5.5482 mL
	20 mM	0.1664 mL	0.8322 mL	1.6644 mL	4.1611 mL
	25 mM	0.1332 mL	0.6658 mL	1.3316 mL	3.3289 mL
	30 mM	0.1110 mL	0.5548 mL	1.1096 mL	2.7741 mL
	40 mM	0.0832 mL	0.4161 mL	0.8322 mL	2.0806 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

	50 mM	0.0666 mL	0.3329 mL	0.6658 mL	1.6644 mL
	60 mM	0.0555 mL	0.2774 mL	0.5548 mL	1.3870 mL
	80 mM	0.0416 mL	0.2081 mL	0.4161 mL	1.0403 mL
	100 mM	0.0333 mL	0.1664 mL	0.3329 mL	0.8322 mL



源叶