



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: **Pizuglanstat**
CAS 号: **1244967-98-3**
产品货号: **S89171**

生物活性:

Description	Pizuglanstat (Compound 3; TAS-205 free base) 是一种口服活性的前列腺素 D 合酶 (prostaglandin D synthase) 抑制剂, 对人造血前列腺素 D 合酶的 IC50 为 76 nM。Pizuglanstat 抑制 PGD2 的合成。Pizuglanstat 改善实验性过敏性鼻炎。Pizuglanstat 可用于肌再生性疾病, 例如肌肉营养不良研究。				
IC50 & Target	DP				
In Vitro	Pizuglanstat (10-3000 nM) 可抑制嗜碱性细胞 (RBL-2H3 和 KU812) 中的 PGD2 合成[2].				
In Vivo	Pizuglanstat (1-60 mg/kg; 口服; 单剂量或每日一次, 持续 15 天) 可抑制实验性过敏性鼻炎豚鼠模型中的晚期鼻塞、嗜酸性粒细胞浸润和鼻灌洗液中的 PGD2 产生[2]。				
	Animal Model:	Male Hartley guinea pigs (3 weeks old at purchase, 5 weeks old at challenge); Ovalbumin-sensitized allergic rhinitis model[2]			
	Dosage:	1, 3, 10, 30, 60 mg/kg			
	Administration:	Oral administration; single dose 1 h before the 3rd challenge, or once daily for 15 days			
	Result:	Dose-dependently reduced PGD ₂ levels in nasal lavage fluid, suppressed late-phase nasal obstruction (area under the curve of specific airway resistance from 3-7 h). Inhibited eosinophil infiltration into the nasal cavity. Had additive effects on eosinophil suppression and late-phase obstruction when used in combination with Montelukast, and when used in combination with Fexofenadine, the suppression of early and late-phase obstruction is comparable to monotherapy.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 12.5 mg/mL (24.58 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9661 mL	9.8307 mL	19.6614 mL
		5 mM	0.3932 mL	1.9661 mL	3.9323 mL
		10 mM	0.1966 mL	0.9831 mL	1.9661 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。					
参考文献	[1]. Yoshihiro Urade, et al. Piperazine compound capable of inhibiting prostaglandin D synthase. United States. US8865714B2. 2010-03-08. [2]. Aoyagi H, et al. Potential synergistic effects of novel hematopoietic prostaglandin D synthase inhibitor TAS-205 and different types of anti-allergic medicine on nasal obstruction in a Guinea pig model of experimental allergic rhinitis. Eur J Pharmacol. 2020 May 15;875:173030. [3]. Komaki H, et al. Early phase 2 trial of TAS-205 in patients with Duchenne muscular dystrophy. Ann Clin				



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

Transl Neurol. 2020 Feb;7(2):181-190.

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	1.9661 mL	9.8307 mL	19.6614 mL	49.1536 mL
	5 mM	0.3932 mL	1.9661 mL	3.9323 mL	9.8307 mL
	10 mM	0.1966 mL	0.9831 mL	1.9661 mL	4.9154 mL
	15 mM	0.1311 mL	0.6554 mL	1.3108 mL	3.2769 mL
	20 mM	0.0983 mL	0.4915 mL	0.9831 mL	2.4577 mL