



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: CCR2 antagonist 4

CAS 号: 226226-39-7

产品货号: S89359

生物活性:				
Description	CCR2 antagonist 4 (Teijin compound 1) 是一种高效、特异的 CCR2 拮抗剂, 对 CCR2b 的 IC50 值为 180 nM。CCR2 antagonist 4 对 MCP-1 诱导的趋化作用有较强的抑制作用, 其 IC50 为 24 nM。			
IC50 & Target[1]	CCR2b 180 nM (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HEK293	IC50	0.98 μ M	Antagonist activity at human CCR2B receptor expressed in HEK293 cells assessed as inhibition of MCP1-induced increase in intracellular calcium level
	HEK293-EBNA	IC50	3.2 μ M	Displacement of [125I]MCP1 from human CCR2B receptor expressed in HEK293-EBNA cells
	THP-1	EC50	0.02 μ M	Inhibition of MCP-1 induced chemotaxis in THP-1 cells
	THP-1	IC50	180 nM	Displacement of [125I]MCP1 from human CCR2b in THP1 cells
	THP-1	IC50	24 nM	Antagonist activity at human CCR2 in THP1 cells assessed as inhibition of MCP1-induced chemotaxis
	THP-1	IC50	> 0.3 μ M	Antagonist activity at CCR2 in human THP1 cells assessed as inhibition of MCP1-induced chemotaxis after 1 hr by crystal violet staining
In Vitro	Ile263 and Thr292 in CCR2 contribute significantly to binding of Teijin compound 1 in CCR2. Residue Glu291 in TM7, a highly conserved residue in many CC chemokine receptors, contributes substantially to binding of the protonated CCR2 antagonist 4, and CCL2. His121 on TM3 and Ile263 on TM6 also strongly interact with CCR2 antagonist 4[2]. In ApoE-deficient mice, Vp-TSL targets specifically aortic plaque endothelial VCAM-1 and CCR2 antagonist 4 reduces the mouse monocyte/macrophage cell line (RAW 264.7) adhesion/ infiltration into the aorta[3].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (113.67 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
		1 mM	2.2735 mL	11.3673 mL
		5 mM	0.4547 mL	2.2735 mL
		10 mM	0.2273 mL	1.1367 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 (5.68 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.68 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 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.68 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]. Moree WJ, et al. Potent antagonists of the CCR2b receptor. Part 3: SAR of the (R)-3-aminopyrrolidine series. Bioorg Med Chem Lett. 2008 Mar 15;18(6):1869-73. [2]. Hall SE, et al. Elucidation of binding sites of dual antagonists in the human chemokine receptors CCR2 and CCR5. Mol Pharmacol. 2009 Jun;75(6):1325-36. [3]. Calin M, et al. VCAM-1 directed target-sensitive liposomes carrying CCR2 antagonists bind to activated endothelium and reduce adhesion and transmigration of monocytes. Eur J Pharm Biopharm. 2015 Jan;89:18-29.

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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				



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: shyyw@sina.com

DMSO	1 mM	2.2735 mL	11.3673 mL	22.7345 mL	56.8363 mL
	5 mM	0.4547 mL	2.2735 mL	4.5469 mL	11.3673 mL
	10 mM	0.2273 mL	1.1367 mL	2.2735 mL	5.6836 mL
	15 mM	0.1516 mL	0.7578 mL	1.5156 mL	3.7891 mL
	20 mM	0.1137 mL	0.5684 mL	1.1367 mL	2.8418 mL
	25 mM	0.0909 mL	0.4547 mL	0.9094 mL	2.2735 mL
	30 mM	0.0758 mL	0.3789 mL	0.7578 mL	1.8945 mL
	40 mM	0.0568 mL	0.2842 mL	0.5684 mL	1.4209 mL
	50 mM	0.0455 mL	0.2273 mL	0.4547 mL	1.1367 mL
	60 mM	0.0379 mL	0.1895 mL	0.3789 mL	0.9473 mL
	80 mM	0.0284 mL	0.1421 mL	0.2842 mL	0.7105 mL
	100 mM	0.0227 mL	0.1137 mL	0.2273 mL	0.5684 mL

源叶