



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: **BMS-986235**
CAS 号: **2253947-47-4**
产品货号: **S89863**

生物活性:

Description	BMS-986235 (LAR-1219) is a selective, orally active formyl peptide receptor 2 (FPR2) agonist, with EC50s of 0.41 nM and 3.4 nM for hFPR2 and mFPR2, respectively. BMS-986235 has potential for the prevention of heart failure[1].				
IC50 & Target	EC50: 0.41 nM (human FPR2), 3.4 nM (mouse FPR2), 2800 nM (human FPR1)[1]				
In Vitro	BMS-986235 (LAR-1219) 抑制中性粒细胞趋化作用并刺激巨噬细胞吞噬作用, 这是促进炎症消退的关键终点[1]。				
In Vivo	BMS-986235 (LAR-1219) (0.3 mg/kg; 口服; 每日一次, 持续 24 天) 可减轻小鼠左前降支 (LAD) 后的左心室和整体心脏重塑[1]。				
	BMS-986235 (1 mg/kg; po) 处理显示 Cmax、T1/2、AUC0-inf, 和生物利用度 (BA) 值分别为 160 nmol/L、0.68 小时、120 nmol/L•h 和 24%[1]。				
	Animal Model:	Male C57BL/6 mice[1]			
	Dosage:	0.3 mg/kg			
	Administration:	P.o.; daily for 24 days			
	Result:	Left ventricle (LV) chamber remodeling is attenuated after myocardial infarction (MI). Reduced infarct length by 39% relative to vehicle.			
	Animal Model:	Male mice (BALB/cCrSlc)[1]			
	Dosage:	1 mg/kg			
	Administration:	P.o. (Pharmacokinetic Analysis)			
	Result:	The Cmax, T1/2, AUC0-inf, and bioavailability (BA) values were 160 nmol/L, 0.68 hours, 120 nmol/L•h, and 24%, respectively.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (276.75 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.7675 mL	13.8374 mL	27.6748 mL
		5 mM	0.5535 mL	2.7675 mL	5.5350 mL
		10 mM	0.2767 mL	1.3837 mL	2.7675 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.92 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 (6.92 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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]. Asahina Y, et al. Discovery of BMS-986235/LAR-1219: A Potent Formyl Peptide Receptor 2 (FPR2) Selective Agonist for the Prevention of Heart Failure [published online ahead of print, 2020 May 24]. J Med Chem. 2020;10.1021/acs.jmedchem.9b02101.

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	2.7675 mL	13.8374 mL	27.6748 mL	69.1869 mL
	5 mM	0.5535 mL	2.7675 mL	5.5350 mL	13.8374 mL
	10 mM	0.2767 mL	1.3837 mL	2.7675 mL	6.9187 mL
	15 mM	0.1845 mL	0.9225 mL	1.8450 mL	4.6125 mL
	20 mM	0.1384 mL	0.6919 mL	1.3837 mL	3.4593 mL
	25 mM	0.1107 mL	0.5535 mL	1.1070 mL	2.7675 mL
	30 mM	0.0922 mL	0.4612 mL	0.9225 mL	2.3062 mL
	40 mM	0.0692 mL	0.3459 mL	0.6919 mL	1.7297 mL
	50 mM	0.0553 mL	0.2767 mL	0.5535 mL	1.3837 mL
	60 mM	0.0461 mL	0.2306 mL	0.4612 mL	1.1531 mL
	80 mM	0.0346 mL	0.1730 mL	0.3459 mL	0.8648 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	0.0277 mL	0.1384 mL	0.2767 mL	0.6919 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶