



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: **CS-833; Vidupiprant ; AMG 853**
CAS 号: **1169483-24-2**
产品货号: **T32798**

生物活性:

Description	Vidupiprant (AMG 853) is a phenylacetic acid derivative. Vidupiprant is a potent and orally active CRTH2 (DP2) and prostanoid D receptor (DP or DP1) dual antagonist with IC50s of 3 nM and 4 nM in buffer, and 8 nM and 35 nM in human plasma, respectively. Vidupiprant has the potential for asthma treatment[1].				
IC50 & Target	DP				
In Vitro	Vidupiprant (AMG 853, Compound 2) inhibits the prostaglandin D2 (PGD2)-induced down-modulation of CRTH2 on CD16 negative granulocytes (eosinophils) in human whole blood with a Kb of 0.2 nM. Vidupiprant also inhibits PGD2-induced cAMP response in platelets in 80% human whole blood with a Kb of 4.7 nM, which is significantly improved, as compared to the Kb of 148 nM of AMG 009. In addition, Vidupiprant demonstrates similar antagonist activity in an aequorin assay using CRTH2-transfected HEK 293 cells and an eosinophil shape change assay, as compared to the CRTH2 receptor down-modulation human whole blood assay[1].				
In Vivo	The significant improvement of DP potency of Vidupiprant (AMG 853, Compound 2) over AMG 009 is also demonstrated in vivo in a guinea pig model of PGD2-induced airway constriction. In this model, airway resistance is measured in response to PGD2 challenge. The in vitro guinea pig DP potency is evaluated in guinea pig whole blood cAMP assay. Vidupiprant has a Kb of 5 nM, while the Kb of AMG 009 is 82 nM[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (164.07 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 / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.6407 mL	8.2036 mL	16.4072 mL
		5 mM	0.3281 mL	1.6407 mL	3.2814 mL
		10 mM	0.1641 mL	0.8204 mL	1.6407 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.10 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。					



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

参考文献

[1]. Liu J, et al. Discovery of AMG 853, a CRTH2 and DP Dual Antagonist. ACS Med Chem Lett. 2011 Mar 2;2(5):326-30.

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	1.6407 mL	8.2036 mL	16.4072 mL	41.0179 mL
	5 mM	0.3281 mL	1.6407 mL	3.2814 mL	8.2036 mL
	10 mM	0.1641 mL	0.8204 mL	1.6407 mL	4.1018 mL
	15 mM	0.1094 mL	0.5469 mL	1.0938 mL	2.7345 mL
	20 mM	0.0820 mL	0.4102 mL	0.8204 mL	2.0509 mL
	25 mM	0.0656 mL	0.3281 mL	0.6563 mL	1.6407 mL
	30 mM	0.0547 mL	0.2735 mL	0.5469 mL	1.3673 mL
	40 mM	0.0410 mL	0.2051 mL	0.4102 mL	1.0254 mL
	50 mM	0.0328 mL	0.1641 mL	0.3281 mL	0.8204 mL
	60 mM	0.0273 mL	0.1367 mL	0.2735 mL	0.6836 mL
	80 mM	0.0205 mL	0.1025 mL	0.2051 mL	0.5127 mL
	100 mM	0.0164 mL	0.0820 mL	0.1641 mL	0.4102 mL