



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: **BAY 60-6583**

CAS 号: **910487-58-0**

产品货号: **T35539**

生物活性:

Description	BAY 60-6583 is a potent and high-affinity agonist of adenosine A2B receptor (EC50=3 nM) over A1, A2A, and A3 receptors. BAY 60-6583 binds to mouse, rabbit, and dog A2BAR with Ki values of 750 nM, 340 nM and 330 nM, respectively. BAY 60-6583 has a cardioprotective effect in a myocardial ischemia model[1][5].																
In Vitro	BAY 60-6583 对 A1 和 A2A AR 的受体激活 EC50 值均 >10,000 nM, 对 A2B AR 亚型的 EC50 值 3 nM 在表达重组人 A1、A2A 或 A2BAR 的 CHO 细胞中[1]。 BAY 60-6583 (0-10 μM) 在没有 siRNA 的情况下表现出 BAY 的最大激动剂作用为 68%, 与存在 5、50 和 500 nM siRNA (分别为 54%、48% 和 36%) 时有显著差异。在 T24 细胞中, 在没有和存在 siRNA 的情况下, BAY 的 EC50 值分别为 98、102、127 和 93 nM[3]。 BAY 60-6583 (5 μM; 24 小时) 增加了 RAW264.7 前破骨细胞中 G1 期细胞的积累, 同时减少了 G2/M 期细胞的积累[4]。 BAY 60-6583 (5 μM; 24 小时) 特异性抑制 M-CSF 对 Akt 的激活, 而 M-CSF 诱导的 ERK1/2 激活不受 RAW264.7 前破骨细胞中 BAY 60-6583 治疗的影响[4]。 Cell Cycle Analysis[4] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>RAW264.7 preosteoclasts</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>5 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>48 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Caused an arrest of cells at the G1 phase.</td></tr></table> Western Blot Analysis[4] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>RAW264.7 preosteoclasts</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>5 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>48 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Exhibited an inhibition of M-CSF-mediated Akt activation and resulted in the decrease of osteoclast proliferation.</td></tr></table>	Cell Line:	RAW264.7 preosteoclasts	Concentration:	5 μM	Incubation Time:	48 hours	Result:	Caused an arrest of cells at the G1 phase.	Cell Line:	RAW264.7 preosteoclasts	Concentration:	5 μM	Incubation Time:	48 hours	Result:	Exhibited an inhibition of M-CSF-mediated Akt activation and resulted in the decrease of osteoclast proliferation.
Cell Line:	RAW264.7 preosteoclasts																
Concentration:	5 μM																
Incubation Time:	48 hours																
Result:	Caused an arrest of cells at the G1 phase.																
Cell Line:	RAW264.7 preosteoclasts																
Concentration:	5 μM																
Incubation Time:	48 hours																
Result:	Exhibited an inhibition of M-CSF-mediated Akt activation and resulted in the decrease of osteoclast proliferation.																
In Vivo	BAY 60-6583 (静脉注射; 100 mcg/kg) 可减少缺血兔心脏再灌注前的梗塞面积[1]。 BAY 60-6583 (腹腔内注射; 2 mg/kg) 可减轻 LPS 诱导的肺损伤, 用 BAY 60-6583 进行预处理可显著降低 WT 小鼠中 LPS 增加的 IL-6 水平, 相反, BAY 60-6583 无法消除 A2BAR 小鼠中的这些炎症参数[2]。 BAY 60-6583 (肿瘤内给药) 可导致肿瘤浸润性 MDSC 显著增加, 既不影响其抑制 T 细胞增殖的能力, 也不影响其成熟程度, 它还会刺激产生 IL-10 和 CCL2 在肿瘤组织中的表达[5]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>A2BAR^{-/-} mice on a C57BL/6J mice[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>2 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Intraperitoneal injection; 2 mg/kg</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Demonstrated attenuation of lung inflammation and pulmonary edema in wild-type but not in gene-targeted mice for the A2BAR.</td></tr></table>	Animal Model:	A2BAR ^{-/-} mice on a C57BL/6J mice[1]	Dosage:	2 mg/kg	Administration:	Intraperitoneal injection; 2 mg/kg	Result:	Demonstrated attenuation of lung inflammation and pulmonary edema in wild-type but not in gene-targeted mice for the A2BAR.								
Animal Model:	A2BAR ^{-/-} mice on a C57BL/6J mice[1]																
Dosage:	2 mg/kg																
Administration:	Intraperitoneal injection; 2 mg/kg																
Result:	Demonstrated attenuation of lung inflammation and pulmonary edema in wild-type but not in gene-targeted mice for the A2BAR.																
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (263.55 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	2.6355 mL	13.1773 mL	26.3546 mL
		5 mM	0.5271 mL	2.6355 mL	5.2709 mL
		10 mM	0.2635 mL	1.3177 mL	2.6355 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: ≥ 4.17 mg/mL (10.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 4.17 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 41.7 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 ddH₂ O 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: ≥ 4.17 mg/mL (10.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 4.17 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 41.7 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]. Aherne CM, et al. Epithelial-specific A2B adenosine receptor signaling protects the colonic epithelial barrier during acute colitis.Mucosal Immunol. 2015 Nov;8(6):1324-38. [2]. Schingnitz U, et al. Signaling through the A2B adenosine receptor dampens endotoxin-induced acute lung injury.J Immunol. 2010 May 1;184(9):5271-9. [3]. Gao ZG, et al. Probing biased/partial agonism at the G protein-coupled A(2B) adenosine receptor.Biochem Pharmacol. 2014 Aug 1;90(3):297-306. [4]. Yoon Taek Oh, et al. A2B Adenosine Receptor Stimulation Down-regulates M-CSF-mediated Osteoclast Proliferation. Biomed Sci Letters 2017;23:194-200 [5]. John A. Auchampach, et al. Characterization of the A2B Adenosine Receptor from Mouse, Rabbit, and Dog. J Pharmacol Exp Ther. 2009 Apr;329(1):2-13. [6]. Morello S1, et al. Targeting the adenosine A2b receptor in the tumor microenvironment overcomes local immunosuppression by myeloid-derived suppressor cells.Oncoimmunology. 2014 Feb 14;3:e27989.				



		eCollection 2014.			
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℃, 2 years; -20℃, 1 year. -80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 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	2.6355 mL	13.1773 mL	26.3546 mL	65.8866 mL
	5 mM	0.5271 mL	2.6355 mL	5.2709 mL	13.1773 mL
	10 mM	0.2635 mL	1.3177 mL	2.6355 mL	6.5887 mL
	15 mM	0.1757 mL	0.8785 mL	1.7570 mL	4.3924 mL
	20 mM	0.1318 mL	0.6589 mL	1.3177 mL	3.2943 mL
	25 mM	0.1054 mL	0.5271 mL	1.0542 mL	2.6355 mL
	30 mM	0.0878 mL	0.4392 mL	0.8785 mL	2.1962 mL
	40 mM	0.0659 mL	0.3294 mL	0.6589 mL	1.6472 mL
	50 mM	0.0527 mL	0.2635 mL	0.5271 mL	1.3177 mL
	60 mM	0.0439 mL	0.2196 mL	0.4392 mL	1.0981 mL
	80 mM	0.0329 mL	0.1647 mL	0.3294 mL	0.8236 mL
	100 mM	0.0264 mL	0.1318 mL	0.2635 mL	0.6589 mL