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

产品名称：AZD1283
产品别名：AZD1283

生物活性：

Description

AZD1283 is a potent antagonist of the P2Y12 receptor with EC50 of 3.0 ug/kg/min, TI >10; with binding IC50 of 11 nM. IC50 value: 3.0 ug/kg/min(EC50) [1] Target: P2Y12 receptor inhibitor AZD1283 dose-dependently induced increases in blood flow and inhibition of ADP-induced platelet aggregation with antithrombotic ED50 values of 3.0 and 10 μg/kg/min, respectively. The doses that induced a larger than 3-fold increase in bleeding time were 33 and 100 μg/kg/min for 3 and 13, respectively. Thus, the therapeutic index (TI) was ≥ 10 for both compounds. On the basis of these data, compound 3 was progressed into human clinical trials as candidate drug AZD1283.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 100 mg/mL (**212.52 mM;** Need ultrasonic)

H_2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.1252 mL	10.6261 mL	21.2522 mL
	5 mM	0.4250 mL	2.1252 mL	4.2504 mL
	10 mM	0.2125 mL	1.0626 mL	2.1252 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.31 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.31 mM，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；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.31 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.31 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。

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。

References	[1]. Bach P, et al. Lead optimization of ethyl 6-aminonicotinate acyl sulfonamides as antagonists of the P2Y12 receptor. separation of the antithrombotic effect and bleeding for candidate drug AZD1283. J Med Chem. 2013 Sep 12;56(17):7015-24.