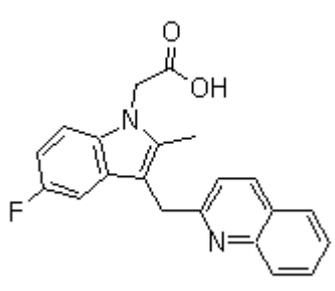


## OC000459

产品编号: MB5086  
质量标准: >98%,BR  
包装规格: 5MG;25MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C21H17FN2O2	结 构 式	
分子量	348.37		
CAS No.	851723-84-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 4 mg/mL (11.48 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介:** OC000459 是 D 型前列腺素受体 2 (DP2) 拮抗剂。

**别名:** OC000459; 1H-Indole-1-acetic acid, 5-fluoro-2-methyl-3-(2-quinolinylmethyl)-

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

溶解性: .....DMSO: 4 mg/mL (11.48 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量: .....>98%

**储存条件:** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	OC000459 是一种有效的, 选择性的 D prostanoid receptor 2 (DP2) (前列腺素受体 D2) 拮抗剂, IC50 为 13 nM。
<b>靶点</b>	DP2 13 nM
<b>体外研究</b>	OC000459 抑制[3H]PGD2 与来自转染人 DP2 的 CHO 细胞中细胞膜的结合, Ki 为 13 nM。OC000459 也会从人 Th2 淋巴细胞的细胞膜取代[3H]PGD2, Ki 为 4 nM。OC000459 剂量依赖性拮抗 PGD2 介导的钙离子动员, 在表达 DP2 的完整 CHO 细胞中, IC50 为 28 nM。OC000459 抑制人 Th2 细胞响应 PGD2 (10 nM)的趋药性, IC50 为 28 nM。在离体白血球制备和肝素化人全血中, OC000459 (< 3 μM) 竞争性拮抗 PGD2 的作用。OC000459 抑制嗜酸性红细胞响应 DK-PGD2 而形变, IC50 为 11 nM。OC000459 (1 μM)抑制 Th2 细胞的活化和嗜酸细胞对肥大细胞上清液的响应。
<b>体内研究</b>	OC000459 以 2 mg/kg 的剂量口服给药, 在 Sprague-Dawley 大鼠体内表现出的血浆半衰期为 2.9 小时, 达到最大血浆浓度的时间为 1.3 小时, 最大血浆浓度为 1.54 μg/mL。DK-PGD2 注射前 0.5 小时, OC000459 口服给药导致血浆嗜酸性粒细胞增多剂量依赖性减少, 在大鼠体内 ED50

为 0.04 mg/kg。DK-PGD2 注射前 0.5 小时，OC000459 口服给药也会剂量依赖性抑制嗜酸性细胞聚集，在大鼠体内，ED50 为 0.01 mg/kg。对全分析(FA)群体和每个方案(PP)群体的分析表明，OC000459 (200 mg，每天两次，给药 28 天)对中度持续性哮喘患者给药，能够改善生活质量。在这些患者中，OC000459 提高夜间症状评分，减少痰嗜酸粒细胞的几何平均计数和呼吸道感染。在固醇类先天性哮喘患者中，OC000459 (200 mg，每天两次)治疗抑制后期哮喘反应和痰嗜酸粒细胞中过敏原增加。

#### 美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB2606	NESS0327
MB5084	AZD1981
MB3818	TAK875

**用途及描述:** 科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。OC000459 是 D 型前列腺素受体 2 (DP2) 拮抗剂。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8705 mL	14.3526 mL	28.7051 mL
5 mM	0.5741 mL	2.8705 mL	5.7410 mL
10 mM	0.2871 mL	1.4353 mL	2.8705 mL
50 mM	-	-	-

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> Sprague-Dawley 大鼠 <b>Formulation:</b> 10% DMSO/生理盐水 <b>Dosages:</b> 10 mg/kg <b>Administration:</b> 口服
-------------	---

#### 【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

#### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装:** 您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备:** 大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储备液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备:** 请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分

化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

#### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。