

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	Z70069
产品名称:	Ziritaxestat

产品简介:

一种创新的 autotaxin (ATX) 抑制剂, IC ₅₀ 和 K _i 值分别为 131 nM 和 15 nM。		
靶点:	Autotaxin	Autotaxin
	131 nM (IC ₅₀)	15 nM (K _i)
体外研究:		
Ziritaxestat (GLPG1690) 在手动膜片钳试验中显示无 CYP3A4 TDI 并降低 hERG 抑制活性, IC ₅₀ 为 15 μM。		
体内研究:		
Ziritaxestat (GLPG1690) 以浓度依赖性方式抑制小鼠、大鼠和健康供体血浆中 ATX 诱导的 LPA 18:2 产生, IC ₅₀ 值分别为 418 nM、542 nM 和 242 nM。		
Ziritaxestat (GLPG1690) 在小鼠和大鼠中表现出改善的药代动力学特性, 具有低血浆清除率和高生物利用度。Ziritaxestat (GLPG1690) 具有低血浆清除率 (0.12 L/h/kg) 和高生物利用度 (63%), 进一步证实了其良好的药代动力学特征。		

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
DMSO:70.84(Max Conc. mg/mL);120.32(Max Conc. mM)Ethanol:4.0(Max Conc. mg/mL);6.79(Max Conc. mM)				
浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
	1 mM			
	5 mM			
10 mM		0.1699 mL	0.8493 mL	1.6987 mL
储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。				
二: 体内实验				
1、请依序添加每种溶剂: 5% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.25 mM); 澄清溶液				
2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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。				
3、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 15% Cremophor EL→85% Saline

Solubility: 20 mg/mL (33.97 mM)；悬浊液；超声助溶

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存： -20° C

