

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	E10225
产品名称:	恩他卡朋

产品简介:

一种有效的、可逆的、外周作用和具有口服活性儿茶酚-O-甲基转移酶 (COMT) 抑制剂。Entacapone 对大鼠脑、红细胞和肝脏 COMT 有抑制作用, IC₅₀ 值分别为 10 nM、20 nM 和 160 nM。Entacapone 对 COMT 的选择性优于其他儿茶酚胺代谢酶, 包括 MAO-A、MAO-B、酚磺基转移酶 M (PST-M) 和 PST-P (IC₅₀s>50 μM)。Entacapone 可用于帕金森病的研究。Entacapone 抑制 FTO 去甲基化活性, IC₅₀ 是 3.5 μM, 可用于研究代谢紊乱。

靶点: IC₅₀: 10 nM (rat brain COMT); 20 nM (rat erythrocyte COMT); 160 nM (rat liver COMT)

体外研究:

Entacapone (50 μM, 48 小时) 可增加 Hep-G2 细胞中 mRNA 上的 m6A 数量。它对 RNA m6A 脱甲基酶 AlkB 同源物 5 (ALKBH5) 或十一-十一易位甲基胞嘧啶双加氧酶 1 (TET1) 的酶活性没有任何抑制作用, 也不会改变 Entacapone 处理的 Hep-G2 细胞中的 DNA 甲基化或组蛋白甲基化模式。

体内研究:

Entacapone (口服; 每天 600 毫克/千克; 3-9 周) 产生剂量反应效应。3 周后, 与对照组相比, 小鼠体重下降了 10.1%, 并且显示出相似的食物摄入量, 但 Entacapone 治疗后脂肪质量和脂肪质量比降低。Entacapone 还能增加小鼠的能量消耗: 小鼠总胆固醇 (17.6%)、低密度脂蛋白胆固醇 (31.0%) 和甘油三酯 (10.2%) 降低。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (20mg/mL)

浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
1 mM		3.2756 mL	16.3779 mL	32.7557 mL
5 mM		0.6551 mL	3.2756 mL	6.5511 mL
10 mM		0.3276 mL	1.6378 mL	3.2756 mL

储备液的保存方式: -80° C, 1 year; -20° C, 6 months.

二: 体内实验

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

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.19 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。

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; 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。

2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: 2.5 mg/mL (8.19 mM); 澄清溶液; 加热助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (6.81 mM); 澄清溶液

此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

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 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。2 g SBE- β -CD (磺丁基醚 β -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

4、请依序添加每种溶剂： PBS

Solubility: 1 mg/mL (3.28 mM); 澄清溶液; 超声助溶 ($<60^{\circ}$ C)

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

$<1\text{mg/mL}$ 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：2-8 $^{\circ}$ C

