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：Mavacoxib
CAS 号：170569-88-7
产品货号：S87700

生物活性：

Description	Mavacoxib 是一种选择性的口服长效环氧合酶 2 (COX-2) 抑制剂，是一种长效的非甾体类抗炎剂 (NSAID)，用于研究犬退化性关节病相关的疼痛和炎症。
IC50 & Target	COX-2[1]
In Vitro	Mavacoxib (0-200 μM; 72 hours; CSKOS, U2OS, REM, K9TCC and T24 cells) treatment reduces cell viability in a dose-dependent manner. However, sensitivity to Mavacoxib varied between the cell lines, with IC50 values ranging from 34.5 μM to 157.7 μM. The IC50 values of U2OS, KTOSA5, CSKOS, REM, LILY, K9TCC, K9TCC-AXA, K9TCC-In, K9TCC-Sh, T24, 5637 and HT-1376 cells are 52.6 μM, 89.8 μM, 106.3 μM, 66.6 μM, 97.5 μM, 54.9 μM, 34.5 μM, 78.7 μM, 50.7 μM, 63.4 μM, 72.5 μM and 157.7 μM, respectively[1]. Mavacoxib (0-200 μM; 48 hours; KTOSA5, REM, LILY, K9TCC, U2OS, and T24 cells) treatment can induce caspase-dependent apoptosis in a number of cell lines[1]. Mavacoxib (0-75 μM; 24 hours; CSKOS, U2OS, REM, K9TCC and T24 cells) treatment down-regulates the expression of p-Akt in CSKOS cells in in a dose-dependent manner, as is total Akt in U2OS cells. In REM cells, both p-ERK and p-Akt are increased in expression with increasing doses of Mavacoxib, and in K9TCC cells p-ERK expression is also increased with Mavacoxib treatment[1]。 Cell Viability Assay[1] Cell Line: CSKOS, U2OS, REM, K9TCC and T24 cells Concentration: 0 μM, 0.04 μM, 25 μM, 50 μM, 75 μM, 100 μM, 125 μM, 150 μM, 175 μM, 200 μM Incubation Time: 72 hours Result: Cell viability was reduced in a dose-dependent manner. Apoptosis Analysis[1] Cell Line: KTOSA5, REM, LILY, K9TCC, U2OS, and T24 cells Concentration: 0 μM, 50 μM, 100 μM, 200 μM Incubation Time: 48 hours Result: Induced apoptosis in canine and human cancer cell lines. Cell Viability Assay[1] Cell Line: CSKOS, U2OS, REM, K9TCC and T24 cells Concentration: 0 μM, 25 μM, 50 μM or 75 μM Incubation Time: 24 hours Result: In CSKOS cells, p-Akt was downregulated, as was total Akt in U2OS cells. In REM cells, both p-ERK and p-Akt were increased in expression, and in K9TCC cells p-ERK expression was also increased.
In Vivo	Osteoarthritic dogs enrolled in the studies are randomized to receive treatment with Mavacoxib and daily placebo for carprofen or placebo for Mavacoxib and daily carprofen at a nominal dose of 4 mg/kg BW. Mavacoxib is administered in both studies with a 2-week interval between the first and second doses but with monthly dosing thereafter. The nominal Mavacoxib doses in Studies 1 and 2 are 4 and 2 mg/kg BW, respectively. Seven Mavacoxib doses are administered in Study 1, but only five doses in Study 2. In Study 1,

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

<table>
<tr><td></td><td>Mavacoxib is administered without regard to the timing of meals, but in Study 2, all of the Mavacoxib doses are administered with food[2]。</td></tr>
<tr><td>Solvent&Solubility</td><td>
细胞实验:
DMSO 中的溶解度 ：100 mg/mL (259.51 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)
<table>
<tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td>Solvent / Mass / Concentration</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr>
<tr><td>1 mM</td><td>2.5951 mL</td><td>12.9756 mL</td><td>25.9511 mL</td></tr>
<tr><td>5 mM</td><td>0.5190 mL</td><td>2.5951 mL</td><td>5.1902 mL</td></tr>
<tr><td>10 mM</td><td>0.2595 mL</td><td>1.2976 mL</td><td>2.5951 mL</td></tr>
</table>
*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: ≥ 2.08 mg/mL (5.40 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。
生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH_2 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% (20% SBE-β-CD in Saline)
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.40 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 900 μL 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。
方案 三
请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.40 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 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
</td></tr>
</table>

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

参考文献	[1]. Hurst EA, et al. The selective cyclooxygenase-2 inhibitor mavacoxib (Trocoxil) exerts anti-tumour effects in vitro independent of cyclooxygenase-2 expression levels. Vet Comp Oncol. 2019 Jun;17(2):194-207. [2]. Cox SR, et al. Population pharmacokinetics of mavacoxib in osteoarthritic dogs. J Vet Pharmacol Ther. 2011 Feb;34(1):1-11.

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°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。

可选溶剂	**质量 / 溶剂体积 / 浓度**	**1 mg**	**5 mg**	**10 mg**	**25 mg**
DMSO	**1 mM**	2.5951 mL	12.9756 mL	25.9511 mL	64.8778 mL
	5 mM	0.5190 mL	2.5951 mL	5.1902 mL	12.9756 mL
	10 mM	0.2595 mL	1.2976 mL	2.5951 mL	6.4878 mL
	15 mM	0.1730 mL	0.8650 mL	1.7301 mL	4.3252 mL
	20 mM	0.1298 mL	0.6488 mL	1.2976 mL	3.2439 mL
	25 mM	0.1038 mL	0.5190 mL	1.0380 mL	2.5951 mL
	30 mM	0.0865 mL	0.4325 mL	0.8650 mL	2.1626 mL
	40 mM	0.0649 mL	0.3244 mL	0.6488 mL	1.6219 mL
	50 mM	0.0519 mL	0.2595 mL	0.5190 mL	1.2976 mL
	60 mM	0.0433 mL	0.2163 mL	0.4325 mL	1.0813 mL
	80 mM	0.0324 mL	0.1622 mL	0.3244 mL	0.8110 mL
	100 mM	0.0260 mL	0.1298 mL	0.2595 mL	0.6488 mL