



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **GSK369796 Dihydrochloride**

CAS 号: **1010411-21-8**

产品货号: **S87768**

生物活性:

Description	GSK369796 Dihydrochloride 是一种经济有效的抗疟药，可抑制 hERG 钾离子通道 (hERG potassium ion channel) 复极化，IC50 值为 7.5 μM。				
IC50 & Target	Plasmodium				
In Vitro	GSK369796 Dihydrochloride 可以抑制 Plasmodium falciparum 菌株 3D7c、HB3c 和 K1d 的生长，IC50 分别为 11.2±2.2、12.6±5.3 和 13.2±3.2 nM。与 Desethyl amodiaquine 相比，GSK369796 Dihydrochloride (compound 4) 在小鼠中的蛋白结合率更高 (93 对 74%)，但在人类中相似 (88 对 86%)。GSK369796 Dihydrochloride 还可以抑制 hERG 钾离子通道复极化，IC50 为 7.5±0.8 μM[1]。				
In Vivo	GSK369796 Dihydrochloride 可以抑制 Plasmodium berghei ANKA 的生长，ED50 和 ED90 分别为 2.8 和 4.7 mg/kg[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度：100 mg/mL (233.22 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) H2O 中的溶解度：50 mg/mL (116.61 mM; 超声助溶)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3322 mL	11.6610 mL	23.3220 mL
		5 mM	0.4664 mL	2.3322 mL	4.6644 mL
		10 mM	0.2332 mL	1.1661 mL	2.3322 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℃, 6 months; -20℃, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。				
	* 备注：如您选择水作为储备液，请稀释至工作液后，再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。				
	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: ≥ 2.5 mg/mL (5.83 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。 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					



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: shyyssw@sina.com

	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.83 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 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。
参考文献	[1]. O'Neill PM, et al. Candidate selection and preclinical evaluation of N-tert-butyl isoquine (GSK369796), an affordable and effective 4-aminoquinoline antimalarial for the 21st century. J Med Chem. 2009 Mar 12;52(5):1408-15.

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, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.3322 mL	11.6610 mL	23.3220 mL	58.3050 mL
	5 mM	0.4664 mL	2.3322 mL	4.6644 mL	11.6610 mL
	10 mM	0.2332 mL	1.1661 mL	2.3322 mL	5.8305 mL
	15 mM	0.1555 mL	0.7774 mL	1.5548 mL	3.8870 mL
	20 mM	0.1166 mL	0.5830 mL	1.1661 mL	2.9152 mL
	25 mM	0.0933 mL	0.4664 mL	0.9329 mL	2.3322 mL
	30 mM	0.0777 mL	0.3887 mL	0.7774 mL	1.9435 mL
	40 mM	0.0583 mL	0.2915 mL	0.5830 mL	1.4576 mL
	50 mM	0.0466 mL	0.2332 mL	0.4664 mL	1.1661 mL
	60 mM	0.0389 mL	0.1943 mL	0.3887 mL	0.9717 mL
	80 mM	0.0292 mL	0.1458 mL	0.2915 mL	0.7288 mL
	100 mM	0.0233 mL	0.1166 mL	0.2332 mL	0.5830 mL