



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: **S-methyl-KE-298**

CAS 号: **143584-75-2**

产品货号: **S87838**

生物活性:				
Description	S-methyl-KE-298 是 KE-298 的一种活性代谢物。KE-298 抑制类风湿关节炎 (RA) 滑膜细胞的基质金属蛋白酶 (MMP-1) 产生。			
In Vitro	S-methyl-KE-298 is a methyl conjugate of deacetyl-KE-298 is plasma[1]. In vitro protein binding of KE-298 and its plasma metabolites, deacetyl-KE-298 (M-1) and S-methyl-KE-298 (M-2), is high in rat (>97%), dog (>89%) and human plasma (>99%), respectively[2]. KE-298 blocks this IL-1 β -induced pro-MMP-2 activation and MT1-MMP expression, but does not affect IL-1 β -induced tissue inhibitor of metalloproteinase-2 (TIMP-2) secretion from rheumatoid synovial cells. KE-298 inhibits MMP-1 production from rheumatoid arthritis (RA) synovial cells by affecting a transcription factor, AP-1. KE-298 inhibits the basal levels of MT1-MMP expression of unstimulated rheumatoid synovial cells[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (396.31 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	3.9631 mL	19.8153 mL
		5 mM	0.7926 mL	3.9631 mL
		10 mM	0.3963 mL	1.9815 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°C, 6 months; -20°C, 1 month。-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。 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: $\geq$ 2.5 mg/mL (9.91 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 ddH₂O 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: $\geq$ 2.5 mg/mL (9.91 mM); 澄清溶液			



	此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \text{ } \mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ } \mu\text{L}$ 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: $10\% \text{ DMSO} \rightarrow 90\% \text{ Corn Oil}$ Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (9.91 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (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 $100 \text{ } \mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ } \mu\text{L}$ 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Yoshida H, et al. Identification of metabolites of KE-298, a new antirheumatic drug, and its physiological properties in rats. Biol Pharm Bull. 1996 Mar;19(3):424-9. [2]. Endo H, et al. Stereoselectivity and species difference in plasma protein binding of KE-298 and its metabolites. Biol Pharm Bull. 2001 Jul;24(7):800-5. [3]. Honda S, et al. Expression of membrane-type 1 matrix metalloproteinase in rheumatoid synovial cells. Clin Exp Immunol. 2001 Oct;126(1):131-6.

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。 -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
DMSO	1 mM	3.9631 mL	19.8153 mL	39.6306 mL	99.0766 mL
	5 mM	0.7926 mL	3.9631 mL	7.9261 mL	19.8153 mL
	10 mM	0.3963 mL	1.9815 mL	3.9631 mL	9.9077 mL
	15 mM	0.2642 mL	1.3210 mL	2.6420 mL	6.6051 mL
	20 mM	0.1982 mL	0.9908 mL	1.9815 mL	4.9538 mL
	25 mM	0.1585 mL	0.7926 mL	1.5852 mL	3.9631 mL
	30 mM	0.1321 mL	0.6605 mL	1.3210 mL	3.3026 mL
	40 mM	0.0991 mL	0.4954 mL	0.9908 mL	2.4769 mL
	50 mM	0.0793 mL	0.3963 mL	0.7926 mL	1.9815 mL
	60 mM	0.0661 mL	0.3303 mL	0.6605 mL	1.6513 mL
	80 mM	0.0495 mL	0.2477 mL	0.4954 mL	1.2385 mL



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

	100 mM	0.0396 mL	0.1982 mL	0.3963 mL	0.9908 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶