



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: NITD-349
CAS 号: 1473450-62-2
产品货号: S87946

生物活性:					
Description	NITD-349 是 MmpL3 的抑制剂, 具有高效的抗分枝杆菌活性, 对结合分枝杆菌 H37Rv 的 MIC50 值为 23 nM。				
IC50 & Target	MIC50: 23 nM (Mycobacterium tuberculosis H37Rv)[1]				
In Vitro	NITD-349 显示出对体外复制结核分枝杆菌 (Mycobacterium tuberculosis) (Mtb) 的杀菌活性, 并且对巨噬细胞内 Mtb 也有活性。这些化合物的杀伤动力学分析表明, 在处理 3 天内, Mtb 细胞的杀伤具有浓度和时间依赖性, 集落形成单位 (CFU) 减少 3 至 4 个对数。NITD-304 的杀灭活性特征类似于 Isoniazid, Isoniazid 在浓度大于 0.2 μ M 时可观察到快速杀灭。NITD349 对各种 MDR Mtb 菌株的 MIC 活性范围为 0.04 至 0.08 μ M。NITD-349 在小鼠和人类肝微粒体中表现出高渗透性和适度的体外代谢清除率[1]。				
In Vivo	在急性小鼠药效模型中, NITD-349 在啮齿动物和狗中显示出良好的口服药代动力学 (PK) 特性, 并且在急性慢性结核分枝杆菌 (Mycobacterium tuberculosis) 感染的小鼠模型中均有效。在急性鼠药效模型中, 用 12.5 和 50 mg/kg 剂量的 NITD-349 处理小鼠导致肺组织 CFU 减少 0.9 和 3.4 个对数。在已建立的感染小鼠模型中, 经过 2 周的处理, NITD-349 的疗效与一线抗结核药物 Rifampicin 相当, 优于 Ethambutol。使用 NITD-349 以 100 mg/kg 的剂量进行为期 4 周的处理可使 CFU 减少 2.38 个对数[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 310 mg/mL (1011.91 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.2642 mL	16.3212 mL	32.6424 mL
		5 mM	0.6528 mL	3.2642 mL	6.5285 mL
		10 mM	0.3264 mL	1.6321 mL	3.2642 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, 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。				
参考文献	[1]. Rao SP, et al. Indolcarboxamide is a preclinical candidate for treating multidrug-resistant tuberculosis. Sci Transl Med. 2013 Dec 4;5(214):214ra168.				

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
------	------------------	------	------	-------	-------



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

DMSO	1 mM	3.2642 mL	16.3212 mL	32.6424 mL	81.6060 mL
	5 mM	0.6528 mL	3.2642 mL	6.5285 mL	16.3212 mL
	10 mM	0.3264 mL	1.6321 mL	3.2642 mL	8.1606 mL
	15 mM	0.2176 mL	1.0881 mL	2.1762 mL	5.4404 mL
	20 mM	0.1632 mL	0.8161 mL	1.6321 mL	4.0803 mL
	25 mM	0.1306 mL	0.6528 mL	1.3057 mL	3.2642 mL
	30 mM	0.1088 mL	0.5440 mL	1.0881 mL	2.7202 mL
	40 mM	0.0816 mL	0.4080 mL	0.8161 mL	2.0402 mL
	50 mM	0.0653 mL	0.3264 mL	0.6528 mL	1.6321 mL
	60 mM	0.0544 mL	0.2720 mL	0.5440 mL	1.3601 mL
	80 mM	0.0408 mL	0.2040 mL	0.4080 mL	1.0201 mL
	100 mM	0.0326 mL	0.1632 mL	0.3264 mL	0.8161 mL

源叶