



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: shyyw@sina.com

产品名称: **ZK824859**
CAS 号: **2254001-81-3**
产品货号: **S87956**

生物活性:

Description	ZK824190 是一种口服有效的选择性尿激酶型纤溶酶原激活剂 (uPA) 抑制剂, 可用于多发性硬化症的研究。ZK824190 对 uPA, tPA 和 Plasmin 的 IC50 分别为 237, 1600 和 1850 nM。				
IC50 & Target	IC50: 237 nM (uPA), 1600 nM (tPA), 1850 nM (Plasmin)[1]				
In Vivo	ZK824190 (2 mg/kg; PO) exhibits a relatively high oral availability and a moderate half time (T1/2=2.8 h)[1]。				
	Animal Model:	Rats with experimental autoimmune encephalomyelitis (EAE) model[1]			
	Dosage:	2 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)			
	Administration:	PO			
	Result:	Oral availability F = 55%; Cmax= 0.64 g/mL and AUC = 2.2 h*g/mL; T1/2=2.8 h.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (603.28 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	10 mg
		1 mM	2.4131 mL	12.0656 mL	24.1313 mL
		5 mM	0.4826 mL	2.4131 mL	4.8263 mL
10 mM		0.2413 mL	1.2066 mL	2.4131 mL	
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 (5.02 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 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% Corn Oil					
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.02 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Islam I, et al. Discovery of selective urokinase plasminogen activator (uPA) inhibitors as a potential treatment for multiple sclerosis. Bioorg Med Chem Lett. 2018 Nov 1;28(20):3372-3375.

完整储备液配制表:

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4131 mL	12.0656 mL	24.1313 mL	60.3282 mL
	5 mM	0.4826 mL	2.4131 mL	4.8263 mL	12.0656 mL
	10 mM	0.2413 mL	1.2066 mL	2.4131 mL	6.0328 mL
	15 mM	0.1609 mL	0.8044 mL	1.6088 mL	4.0219 mL
	20 mM	0.1207 mL	0.6033 mL	1.2066 mL	3.0164 mL
	25 mM	0.0965 mL	0.4826 mL	0.9653 mL	2.4131 mL
	30 mM	0.0804 mL	0.4022 mL	0.8044 mL	2.0109 mL
	40 mM	0.0603 mL	0.3016 mL	0.6033 mL	1.5082 mL
	50 mM	0.0483 mL	0.2413 mL	0.4826 mL	1.2066 mL
	60 mM	0.0402 mL	0.2011 mL	0.4022 mL	1.0055 mL
	80 mM	0.0302 mL	0.1508 mL	0.3016 mL	0.7541 mL
	100 mM	0.0241 mL	0.1207 mL	0.2413 mL	0.6033 mL