



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: **Mirogabalin besylate**

CAS 号: **1138245-21-2**

产品货号: **S88276**

生物活性:

Description	Mirogabalin besylate 是一种选择性的, 可口服的电压门控性钙通道 (voltage-gated calcium channels) 亚基 $\alpha 2 \delta$ 的有效配体, 对人 $\alpha 2 \delta -1$ 和 $\alpha 2 \delta -2$, 大鼠 $\alpha 2 \delta -1$ 和 $\alpha 2 \delta -2$ 的 Kd 值分别为 13.5 nM, 22.7 nM, 27 nM 和 47.6 nM。			
IC50 & Target	Kd: 13.5 nM (Human $\alpha 2 \delta -1$), 22.7 nM (Human $\alpha 2 \delta -2$), 27 nM (Rat $\alpha 2 \delta -1$), 47.6 nM (Rat $\alpha 2 \delta -2$)[1]			
In Vitro	Mirogabalin besylate is a ligand for the $\alpha 2 \delta$ subunit of voltage-gated calcium channels, with Kds of 13.5 nM, 22.7 nM, 27 nM, and 47.6 nM for human $\alpha 2 \delta -1$, human $\alpha 2 \delta -2$, rat $\alpha 2 \delta -1$, and rat $\alpha 2 \delta -2$, respectively. Mirogabalin shows binding affinity for the gabapentin binding site in rat cortical brain homogenates with the IC50 value of 16.0 nM. Mirogabalin has no effect on any other receptors, channels, transporters, or enzymes at 50 μ M[1]。			
In Vivo	Mirogabalin besylate (3 and 10 mg/kg) markedly increases AUC0-8 hours values in a dose-dependent manner in partial sciatic nerve ligation model rats. Mirogabalin (2.5, 5, and 10 mg/kg) causes significant and dose-dependent increase in AUC0-12 hours values and enhances analgesic effects, with estimated ED50 of 4.4, 3.1, and <2.5 mg/kg on day 1, day 3, and day 5, respectively. Moreover, Mirogabalin besylate shows no obvious effect on rota-rod performance and locomotor activity at 3 and 10 mg/kg via oral administration, exhibits significant inhibition on rota-rod performance at 10, 30, and 100 mg/kg, and decreases locomotor activity at 30 and 100 mg/kg in rats[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (272.14 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)			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.7214 mL	13.6069 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5443 mL	2.7214 mL
		10 mM	0.2721 mL	1.3607 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 (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。 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: ≥ 2.58 mg/mL (7.02 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.58 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。				



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.8 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.58 mg/mL (7.02 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.58 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.8 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.58 mg/mL (7.02 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.58 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 25.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Domon Y, et al. Binding Characteristics and Analgesic Effects of Mirogabalin, a Novel Ligand for the α 2 δ Subunit of Voltage-Gated Calcium Channels. J Pharmacol Exp Ther. 2018 Jun;365(3):573-582.

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
DMSO	1 mM	2.7214 mL	13.6069 mL	27.2138 mL	68.0346 mL
	5 mM	0.5443 mL	2.7214 mL	5.4428 mL	13.6069 mL
	10 mM	0.2721 mL	1.3607 mL	2.7214 mL	6.8035 mL
	15 mM	0.1814 mL	0.9071 mL	1.8143 mL	4.5356 mL
	20 mM	0.1361 mL	0.6803 mL	1.3607 mL	3.4017 mL
	25 mM	0.1089 mL	0.5443 mL	1.0886 mL	2.7214 mL
	30 mM	0.0907 mL	0.4536 mL	0.9071 mL	2.2678 mL
	40 mM	0.0680 mL	0.3402 mL	0.6803 mL	1.7009 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

	50 mM	0.0544 mL	0.2721 mL	0.5443 mL	1.3607 mL
	60 mM	0.0454 mL	0.2268 mL	0.4536 mL	1.1339 mL
	80 mM	0.0340 mL	0.1701 mL	0.3402 mL	0.8504 mL
	100 mM	0.0272 mL	0.1361 mL	0.2721 mL	0.6803 mL



源叶