



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: **ELQ-300**
CAS 号: **1354745-52-0**
产品货号: **S88368**

生物活性:

Description	ELQ-300 是一种有效的、有口服生物活性的抗疟疾剂, 结合并抑制细胞色素 bc1 复合物 (cyt bc1) 的还原 (Qi) 位点。ELQ-300 抑制恶性疟原虫 Dd2, Tm90-C2B 和 D1 的 IC50 值分别为 6.6, 4.6 和 160 nM。ELQ-300 可用于抗疟疾的研究。				
IC50 & Target	IC50: 6.6 nM (P. falciparum Dd2), 4.6 nM (P. falciparum Tm90-C2B), 160 nM (P. falciparum D1)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of human cytochrome bc1 complex derived from HEK293 cell mitochondria using 50 uM decylubiquinol as substrate	
	HepG2	IC ₅₀	> 10 μM	Cytotoxicity against human HepG2 cells after 24 hrs incubation by Alamar Blue assay	
	HepG2	IC ₅₀	> 10 μM	Cytotoxicity against human HepG2 cells	
In Vitro	ELQ-300 (0-70 nM, 21 d) inhibits P. falciparum Dd2, Tm90-C2B, and D1 growth with IC50 values of 6.6, 4.6 and 160 nM, respectively[1].				
In Vivo	ELQ-300 (1 and 10 mg/kg; p.o. once daily for 1 or 4 days) inhibits P. yoelii growth in an acute infection model[2].				
	ELQ-300 (10 and 20 mg/kg; p.o. once daily for 1 or 4 days) prevents recurrence of infection in mice[2].				
	Animal Model:		6-week female CF-1 mice with P. yoelii-WT infection[2]		
	Dosage:		1 and 10 mg/kg		
	Administration:		Oral gavage; 1 mg/kg once daily for 4-day; 10 mg/kg once daily for 1-day		
	Result:		Inhibited <i>P. yoelii</i> with ED ₅₀ values of 0.04 and 0.03 mg/kg for 4-day dosing and 1-day dosing, respectively.		
	Animal Model:		6-week female CF-1 mice with P. yoelii-WT infection[2]		
	Dosage:		10 and 20 mg/kg		
	Administration:		Oral gavage; 10 mg/kg once daily for 4-day; 20 mg/kg once daily for 1-day		
	Result:		Effectively prevented recrudescence in the 4-day dosing studies with infection mice.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 15.62 mg/mL (32.83 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 : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1015 mL	10.5077 mL	21.0155 mL
5 mM		0.4203 mL	2.1015 mL	4.2031 mL	
10 mM		0.2102 mL	1.0508 mL	2.1015 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。 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: 2.25 mg/mL (4.73 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.25 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 22.5 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。
参考文献	[1]. Stickles AM, et al. Subtle changes in endochin-like quinolone structure alter the site of inhibition within the cytochrome bc1 complex of Plasmodium falciparum. Antimicrob Agents Chemother. 2015 Apr;59(4):1977-82. [2]. Stickles AM, et al. Atovaquone and ELQ-300 Combination Therapy as a Novel Dual-Site Cytochrome bc1 Inhibition Strategy for Malaria. Antimicrob Agents Chemother. 2016 Jul 22;60(8):4853-9.

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
DMSO	1 mM	2.1015 mL	10.5077 mL	21.0155 mL	52.5387 mL
	5 mM	0.4203 mL	2.1015 mL	4.2031 mL	10.5077 mL
	10 mM	0.2102 mL	1.0508 mL	2.1015 mL	5.2539 mL
	15 mM	0.1401 mL	0.7005 mL	1.4010 mL	3.5026 mL
	20 mM	0.1051 mL	0.5254 mL	1.0508 mL	2.6269 mL
	25 mM	0.0841 mL	0.4203 mL	0.8406 mL	2.1015 mL
	30 mM	0.0701 mL	0.3503 mL	0.7005 mL	1.7513 mL