



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: **ABX-1431; Elcubragistat**

CAS 号: **1446817-84-0**

产品货号: **S88407**

生物活性:				
Description	Elcubragistat (ABX-1431) 是一种高效, 选择性和口服可用的 CNS-渗透性单酰基甘油脂肪酶 (MAGL) 抑制剂, IC50 为 14 nM。			
IC50 & Target	IC50: 14 nM (human MGLL)[1]			
In Vitro	Elcubragistat (ABX-1431) 是一种有效的人类 MGLL 抑制剂 (IC50=0.014 μ M), 对 ABHD6 的选择性是 100 倍以上, 对 PLA2G7 的选择性是 200 倍以上。Elcubragistat 抑制人类 PC3 细胞, IC50 为 0.0022 μ M。在基于细胞的测定中, 与 ABHD6 (IC50=0.253 μ M) 和 PLA2G7 (IC50=494 μ M) 相比, MGLL 的选择性保持了 100 倍以上[1]。			
In Vivo	Elcubragistat (ABX-1431) 可抑制啮齿动物脑中的 MGLL 活性 (ED50=0.5-1.4 mg/kg), 增加脑中 2-AG 浓度, 并抑制大鼠福尔马林疼痛模型中的疼痛行为[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (492.72 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	1.9709 mL	9.8544 mL
		5 mM	0.3942 mL	1.9709 mL
		10 mM	0.1971 mL	0.9854 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.10 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 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 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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 ddH ₂ O 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: 2.08 mg/mL (4.10 mM); 悬浊液; 超声助溶			



	此方案可获得 2.08 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 20.8 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.10 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 μL 20.8 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]. Cisar JS, et al. Identification of ABX-1431, a Selective Inhibitor of Monoacylglycerol Lipase and Clinical Candidate for Treatment of Neurological Disorders. J Med Chem. 2018 Oct 25;61(20):9062-9084.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	1.9709 mL	9.8544 mL	19.7087 mL	49.2718 mL
	5 mM	0.3942 mL	1.9709 mL	3.9417 mL	9.8544 mL
	10 mM	0.1971 mL	0.9854 mL	1.9709 mL	4.9272 mL
	15 mM	0.1314 mL	0.6570 mL	1.3139 mL	3.2848 mL
	20 mM	0.0985 mL	0.4927 mL	0.9854 mL	2.4636 mL
	25 mM	0.0788 mL	0.3942 mL	0.7883 mL	1.9709 mL
	30 mM	0.0657 mL	0.3285 mL	0.6570 mL	1.6424 mL
	40 mM	0.0493 mL	0.2464 mL	0.4927 mL	1.2318 mL
	50 mM	0.0394 mL	0.1971 mL	0.3942 mL	0.9854 mL
	60 mM	0.0328 mL	0.1642 mL	0.3285 mL	0.8212 mL
	80 mM	0.0246 mL	0.1232 mL	0.2464 mL	0.6159 mL
	100 mM	0.0197 mL	0.0985 mL	0.1971 mL	0.4927 mL