



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: **M-5717; Cabamiquine; DDD107498; DDD-498**
CAS 号: **1469439-69-7**
产品货号: **S88412**

生物活性:				
Description	Cabamiquine (DDD107498) 是一种有效、可口服的抗疟疾 (antimalarial) 剂, 能够抑制寄生虫生命周期的多个阶段, 对 P. falciparum 3D7 的 EC50 值为 1 nM。Cabamiquine 通过靶作用于 eEF2/CaMKIII 来抑制蛋白合成, 对 WT-PfeEF2 的 EC50 值为 2 nM。			
IC50 & Target	CaMK III	Plasmodium		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	L6	IC ₅₀	28.47 μ M	Cytotoxicity against rat L6 cells after 70 hrs by alamar blue staining based fluorometric assay
	MRC5	EC ₅₀	24 μ M	Antiproliferative activity against human MRC5 cells assessed as reduction in cell viability after 68 hrs by resazurin dye based fluorescence assay
In Vitro	Cabamiquine (24-48 小时) 会导致滋养体异常, 并抑制寄生虫中滋养体和裂殖体的发育, 并抑制蛋白质合成[1]。 Cabamiquine 对 3D7 寄生虫表现出优异的活性: EC50 =1.0 nM、EC90 = 2.4 nM、EC99 = 5.9 nM[1]。 Cabamiquine 与肝微粒体或肝细胞一起孵育时表现出良好的代谢稳定性[1]。			
In Vivo	Cabamiquine (口服, 单剂量) 在感染疟动物寄生虫的小鼠中显示 ED90 (寄生虫血症减少 90%) 为 0.57 mg/kg[1]。 Cabamiquine (口服, 3 mg/kg) 显示 Cmax 为 80 ng/mL, Tmax 为 4 小时, AUC 为 200542 ng • min/mL, F (%) 为 84%[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (216.19 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	2.1619 mL	10.8094 mL
		5 mM	0.4324 mL	2.1619 mL
		10 mM	0.2162 mL	1.0809 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 (protect from light)。-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;			



	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Baragaña B, et al. A novel multiple-stage antimalarial agent that inhibits protein synthesis. Nature. 2015 Jun 18;522(7556):315-20. [2]. Baragaña B, et al. Discovery of a Quinoline-4-carboxamide Derivative with a Novel Mechanism of Action, Multistage Antimalarial Activity, and Potent in Vivo Efficacy. J Med Chem. 2016 Nov 10;59(21):9672-9685.

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 (protect from light)。-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	2.1619 mL	10.8094 mL	21.6188 mL	54.0470 mL
	5 mM	0.4324 mL	2.1619 mL	4.3238 mL	10.8094 mL
	10 mM	0.2162 mL	1.0809 mL	2.1619 mL	5.4047 mL
	15 mM	0.1441 mL	0.7206 mL	1.4413 mL	3.6031 mL
	20 mM	0.1081 mL	0.5405 mL	1.0809 mL	2.7024 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: shyyssw@sina.com

	25 mM	0.0865 mL	0.4324 mL	0.8648 mL	2.1619 mL
	30 mM	0.0721 mL	0.3603 mL	0.7206 mL	1.8016 mL
	40 mM	0.0540 mL	0.2702 mL	0.5405 mL	1.3512 mL
	50 mM	0.0432 mL	0.2162 mL	0.4324 mL	1.0809 mL
	60 mM	0.0360 mL	0.1802 mL	0.3603 mL	0.9008 mL
	80 mM	0.0270 mL	0.1351 mL	0.2702 mL	0.6756 mL
	100 mM	0.0216 mL	0.1081 mL	0.2162 mL	0.5405 mL



源叶