



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: **Diroximel fumarate (ALKS 8700)**

CAS 号: **1577222-14-0**

产品货号: **S88432**

生物活性:

Description	Diroximel fumarate (ALKS 8700) 是一种具有口服活性的富马酸单乙酯 (MMF) 的前体活性分子, 为一种控释制剂。Diroximel fumarate 被认为与其活性代谢物富马酸二甲酯 (DMF) 的活性等效。Diroximel fumarate 具有良好的安全性和有效性, 有助于多发性硬化 (MS) 研究的潜力。Diroximel fumarate 是一种 Nrf2 激活剂, 可缓解 MGO 引起的疼痛超敏反应。			
In Vitro	Diroximel fumarate (60-100 mg/kg, 口服, 每日一次, 5 天) 可预防雄性和雌性野生型 C57BL/6 小鼠中 MGO 诱导的机械过敏和冷过敏反应[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (489.77 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 : ≥ 10 mg/mL (39.18 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
				10 mg
		1 mM	3.9182 mL	19.5909 mL
		5 mM	0.7836 mL	3.9182 mL
		10 mM	0.3918 mL	1.9591 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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。 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: 2.08 mg/mL (8.15 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 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 (8.15 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 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: ≥ 2.08 mg/mL (8.15 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 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]. Angela Wehr, et al. Relative Bioavailability of Monomethyl Fumarate after Administration of ALKS 8700 in Healthy Subjects (P1.403). Neurology. Apr 2018. [2]. Yousuf MS, et al. Diroximel fumarate acts through Nrf2 to attenuate methylglyoxal-induced nociception in mice and decreases ISR activation in DRG neurons. bioRxiv [Preprint]. 2023 Dec 23:2023.12.22.572877.

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
H ₂ O /DMSO	1 mM	3.9182 mL	19.5909 mL	39.1819 mL	97.9547 mL
	5 mM	0.7836 mL	3.9182 mL	7.8364 mL	19.5909 mL
	10 mM	0.3918 mL	1.9591 mL	3.9182 mL	9.7955 mL
	15 mM	0.2612 mL	1.3061 mL	2.6121 mL	6.5303 mL
	20 mM	0.1959 mL	0.9795 mL	1.9591 mL	4.8977 mL
	25 mM	0.1567 mL	0.7836 mL	1.5673 mL	3.9182 mL
	30 mM	0.1306 mL	0.6530 mL	1.3061 mL	3.2652 mL
DMSO	40 mM	0.0980 mL	0.4898 mL	0.9795 mL	2.4489 mL
	50 mM	0.0784 mL	0.3918 mL	0.7836 mL	1.9591 mL
	60 mM	0.0653 mL	0.3265 mL	0.6530 mL	1.6326 mL
	80 mM	0.0490 mL	0.2449 mL	0.4898 mL	1.2244 mL
	100 mM	0.0392 mL	0.1959 mL	0.3918 mL	0.9795 mL

*备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。