



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: **GLPG11690**
CAS 号: **1628260-79-6**
产品货号: **S88449**

生物活性:

Description	Ziritaxestat (GLPG1690) 是创新的 autotaxin (ATX) 抑制剂, IC ₅₀ 和 K _i 值分别为 131 nM 和 15 nM。			
IC ₅₀ & Target[1]	Autotaxin 131 nM (IC ₅₀)	Autotaxin 15 nM (K _i)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A549	IC ₅₀	> 15 μ M	Antiproliferative activity against human A549 cells measured after 72 hrs by MTT assay
	A549	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human A549 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	Hep 3B2	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human Hep3B cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	MCF7	IC ₅₀	8.32 μ M	Antiproliferative activity against human MCF7 cells measured after 72 hrs by MTT assay
	MCF7	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human MCF-7 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	MDA-MB-231	IC ₅₀	6.27 μ M	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells measured after 72 hrs by MTT assay
	MDA-MB-231	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human MDA-MB-231 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	NCI-H1581	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human NCI-H1581 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	NCI-H2228	IC ₅₀	> 15 μ M	Antiproliferative activity against human NCI-H2228 cells measured after 72 hrs by MTT assay
	NCI-H2228	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against human H2228 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	RAW264.7	IC ₅₀	> 20 μ M	Cytotoxicity against mouse RAW264.7 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
In Vitro	Ziritaxestat (GLPG1690) 在手动膜片钳试验中显示无 CYP3A4 TDI 并降低 hERG 抑制活性, IC ₅₀ 为 15 μ M[1].			
In Vivo	Ziritaxestat (GLPG1690) 以浓度依赖性方式抑制小鼠、大鼠和健康供体血浆中 ATX 诱导的 LPA 18:2 产生, IC ₅₀ 值分别为 418 nM、542 nM 和 242 nM。 Ziritaxestat (GLPG1690) 在小鼠和大鼠中表现出改善的药代动力学特性, 具有低血浆清除率和高			



	生物利用度。Ziritaxestat (GLPG1690) 具有低血浆清除率 (0.12 L/h/kg) 和高生物利用度 (63%), 进一步证实了其良好的药代动力学特征[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 41.67 mg/mL (70.78 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 Preparing Stock Solutions		1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.6987 mL	8.4933 mL	16.9866 mL
		5 mM	0.3397 mL	1.6987 mL	3.3973 mL
		10 mM	0.1699 mL	0.8493 mL	1.6987 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: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.25 mM); 澄清溶液 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.53 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 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 ddH₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.53 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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					



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

	请依序添加每种溶剂: 15% Cremophor EL → 85% Saline Solubility: 20 mg/mL (33.97 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Desroy N, et al. Discovery of 2-[[2-Ethyl-6-[4-[2-(3-hydroxyazetidin-1-yl)-2-oxoethyl]piperazin-1-yl]-8-methylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl]methylamino]-4-(4-fluorophenyl)thiazole-5-carbonitrile (GLPG1690), a First-in-Class Autotaxin Inhibitor Undergoing Clinical Evaluation for the Treatment of Idiopathic Pulmonary Fibrosis. J Med Chem. 2017 May 11;60(9):3580-3590.

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	1.6987 mL	8.4933 mL	16.9866 mL	42.4665 mL
	5 mM	0.3397 mL	1.6987 mL	3.3973 mL	8.4933 mL
	10 mM	0.1699 mL	0.8493 mL	1.6987 mL	4.2466 mL
	15 mM	0.1132 mL	0.5662 mL	1.1324 mL	2.8311 mL
	20 mM	0.0849 mL	0.4247 mL	0.8493 mL	2.1233 mL
	25 mM	0.0679 mL	0.3397 mL	0.6795 mL	1.6987 mL
	30 mM	0.0566 mL	0.2831 mL	0.5662 mL	1.4155 mL
	40 mM	0.0425 mL	0.2123 mL	0.4247 mL	1.0617 mL
	50 mM	0.0340 mL	0.1699 mL	0.3397 mL	0.8493 mL
	60 mM	0.0283 mL	0.1416 mL	0.2831 mL	0.7078 mL