



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: **CS-2624; (R)-GNE-140**

CAS 号: **2003234-63-5**

产品货号: **S88549**

生物活性:

Description	(R)-GNE-140 是一种有效的 LDHA 抑制剂, 对 LDHA 和 LDHB 的 IC ₅₀ 值分别为 3 nM 和 5 nM; (R)-GNE-140 的活性是 S 型异构体的 18 倍。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 3 nM (LDHA), 5 nM (LDHB)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A549	IC ₅₀	0.36 μ M	Antiproliferative activity against human A549 cells assessed as reduction in cell viability at incubated for 72 hrs by MTT assay
	A673	IC ₅₀	2.63 μ M	Cytotoxicity against human A673 cells after 48 hrs by CellTiter-Glo assay
	MG-63	IC ₅₀	0.66 μ M	Antiproliferative activity against human MG63 cells after 72 hrs by MTT assay
	MIA PaCa-2	IC ₅₀	0.48 μ M	Antiproliferative activity against human MIA PaCa2 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 72 hrs by MTT assay
	MIA PaCa-2	IC ₅₀	1.24 μ M	Cytotoxicity against human MIA PaCa2 cells after 48 hrs by CellTiter-Glo assay
In Vitro	(R)- GNE-140 在 5 μ M 的浓度值下对测试的 347 种癌细胞系中的 37 种细胞显示抑制增殖。 (R)- GNE-140 对两种具有 IDH1 突变的骨肉瘤 (骨) 癌细胞系具有抑制作用, IC ₅₀ 为 0.8 μ M[1]。			
In Vivo	(R)-GNE-140 (5 mg/kg) 在小鼠体内具有高生物利用度。在 50 至 200 mg/kg 的较高口服剂量下, (R)-GNE-140 显示出更大的暴露量。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : $\geq$ 50 mg/mL (100.19 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.0038 mL	10.0192 mL
		5 mM	0.4008 mL	2.0038 mL
		10 mM	0.2004 mL	1.0019 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, 1 year; -20°C, 6 months。 -80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.01 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 (5.01 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 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 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 (5.01 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: 2.5 mg/mL (5.01 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Purkey HE, et al. Cell Active Hydroxylactam Inhibitors of Human Lactate Dehydrogenase with Oral Bioavailability in Mice. ACS Med Chem Lett. 2016 Aug 26;7(10):896-901.

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, 1 year; -20° C, 6 months. -80° C 储存时, 请在 1 年内使用, -20° C 储存时, 请在 6 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	2.0038 mL	10.0192 mL	20.0385 mL	50.0962 mL
	5 mM	0.4008 mL	2.0038 mL	4.0077 mL	10.0192 mL
	10 mM	0.2004 mL	1.0019 mL	2.0038 mL	5.0096 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

	15 mM	0.1336 mL	0.6679 mL	1.3359 mL	3.3397 mL
	20 mM	0.1002 mL	0.5010 mL	1.0019 mL	2.5048 mL
	25 mM	0.0802 mL	0.4008 mL	0.8015 mL	2.0038 mL
	30 mM	0.0668 mL	0.3340 mL	0.6679 mL	1.6699 mL
	40 mM	0.0501 mL	0.2505 mL	0.5010 mL	1.2524 mL
	50 mM	0.0401 mL	0.2004 mL	0.4008 mL	1.0019 mL
	60 mM	0.0334 mL	0.1670 mL	0.3340 mL	0.8349 mL
	80 mM	0.0250 mL	0.1252 mL	0.2505 mL	0.6262 mL
	100 mM	0.0200 mL	0.1002 mL	0.2004 mL	0.5010 mL



源叶