



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: **BAY-8002**
CAS 号: **724440-27-1**
产品货号: **S88706**

生物活性:

Description	BAY-8002 是一种有效、选择性、可口服的单羧酸转运蛋白第 1 亚型 (monocarboxylate transporter 1 (MCT1)) 抑制剂, 在表达 MCT1 的 DLD-1 细胞中, IC50 值为 85 nM, 对 MCT1 的选择性远高于 MCT4。具有抗肿瘤活性。				
IC50 & Target	MCT1				
In Vitro	BAY-8002 是 MCT1 的抑制剂, 在表达 MCT1 的 DLD-1 细胞中 IC50 为 85 nM, 对 MCT4 表现出优异的选择性 (在 EVSA-T 细胞中 IC50 >50 μM) [1]				
In Vivo	BAY-8002 (80 和 160 mg/kg, 口服, 每日两次, 疗程超过 26 天) 显著抑制了 Raji 肿瘤小鼠的肿瘤生长[1]。				
	Animal Model:	Female NOD SCID mice bearing Raji cells (7-10 weeks old)[1]			
	Dosage:	80 and 160 mg/kg			
	Administration:	P.O. twice daily for more than 26 days			
	Result:	Inhibited tumor growth with no obvious body weight loss, but showed no effect on tumor regression.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (300.59 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	10 mg
		1 mM	2.4047 mL	12.0236 mL	24.0471 mL
		5 mM	0.4809 mL	2.4047 mL	4.8094 mL
		10 mM	0.2405 mL	1.2024 mL	2.4047 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.00 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 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: 2.08 mg/mL (5.00 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.00 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]. Quanz M, et al. Preclinical Efficacy of the Novel Monocarboxylate Transporter 1 Inhibitor BAY-8002 and Associated Markers of Resistance. Mol Cancer Ther. 2018 Nov;17(11):2285-2296

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. -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	2.4047 mL	12.0236 mL	24.0471 mL	60.1178 mL
	5 mM	0.4809 mL	2.4047 mL	4.8094 mL	12.0236 mL
	10 mM	0.2405 mL	1.2024 mL	2.4047 mL	6.0118 mL
	15 mM	0.1603 mL	0.8016 mL	1.6031 mL	4.0079 mL
	20 mM	0.1202 mL	0.6012 mL	1.2024 mL	3.0059 mL
	25 mM	0.0962 mL	0.4809 mL	0.9619 mL	2.4047 mL
	30 mM	0.0802 mL	0.4008 mL	0.8016 mL	2.0039 mL
	40 mM	0.0601 mL	0.3006 mL	0.6012 mL	1.5029 mL
	50 mM	0.0481 mL	0.2405 mL	0.4809 mL	1.2024 mL
	60 mM	0.0401 mL	0.2004 mL	0.4008 mL	1.0020 mL
	80 mM	0.0301 mL	0.1503 mL	0.3006 mL	0.7515 mL
	100 mM	0.0240 mL	0.1202 mL	0.2405 mL	0.6012 mL