



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Enarodustat**  
CAS 号: **1262132-81-9**  
产品货号: **S89055**

**生物活性:**

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                |                                   |             |             |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------|-------------|-------------|
| <b>Description</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | Enarodustat 是一种有效的, 可口服的 hypoxia-inducible factor prolyl hydroxylase 抑制剂, EC50 of 0.22 $\mu$ M。Enarodustat 有潜力用于肾性贫血的研究。                                                                                       |                                   |             |             |
| <b>IC50 &amp; Target</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | EC50: 0.22 $\mu$ M (factor prolyl hydroxylase)[1]                                                                                                                                                              |                                   |             |             |
| <b>In Vitro</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | Enarodustat (JTZ-951) 是一种强效、口服有效的缺氧诱导因子脯氨酰羟化酶抑制剂, EC50 为 0.22 $\mu$ M。Enarodustat 对 CYP (IC50 > 100 $\mu$ M; CYP3A4/5、CYP2C9、CYP2D6、CYP1A2、CYP2A6、CYP2C19、CYP2C8、CYP2B6) 和 hERG (IC50 > 100 $\mu$ M)均无抑制作用[1]。 |                                   |             |             |
| <b>In Vivo</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | Enarodustat (1 和 3 mg/kg, 口服) 在大鼠每日口服给药后以剂量依赖性方式提高血红蛋白水平[1]。                                                                                                                                                   |                                   |             |             |
| <b>Solvent&amp;Solubility</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | <b>细胞实验:</b><br>DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (244.85 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)                                                                                                                |                                   |             |             |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | <b>Preparing Stock Solutions</b>                                                                                                                                                                               | <b>Solvent Mass Concentration</b> | <b>1 mg</b> | <b>5 mg</b> |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                | 1 mM                              | 2.9383 mL   | 14.6916 mL  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                | 5 mM                              | 0.5877 mL   | 2.9383 mL   |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                                                | 10 mM                             | 0.2938 mL   | 1.4692 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。<br>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。<br><b>动物实验:</b><br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br><b>方案 一</b><br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline<br>Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (6.11 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 $\mu$ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 $\mu$ L 生理盐水 定容至 1 mL。<br>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH <sub>2</sub> O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。<br><b>方案 二</b><br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- $\beta$ -CD in Saline)<br>Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (6.11 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 $\mu$ L 20% 的 SBE- $\beta$ -CD |                                                                                                                                                                                                                |                                   |             |             |



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>2 g SBE-<math>\beta</math>-CD (磺丁基醚 <math>\beta</math>-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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO <math>\rightarrow</math> 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.08</math> mg/mL (6.11 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.08</math> 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中, 混合均匀。</p> |
| 参考文献 | [1]. Ogoshi Y, et al. Discovery of JTZ-951: A HIF Prolyl Hydroxylase Inhibitor for the Treatment of Renal Anemia. ACS Med Chem Lett. 2017 Nov 20;8(12):1320-1325.                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |

#### 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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 2.9383 mL | 14.6916 mL | 29.3832 mL | 73.4581 mL |
|      | 5 mM             | 0.5877 mL | 2.9383 mL  | 5.8766 mL  | 14.6916 mL |
|      | 10 mM            | 0.2938 mL | 1.4692 mL  | 2.9383 mL  | 7.3458 mL  |
|      | 15 mM            | 0.1959 mL | 0.9794 mL  | 1.9589 mL  | 4.8972 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1469 mL | 0.7346 mL  | 1.4692 mL  | 3.6729 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1175 mL | 0.5877 mL  | 1.1753 mL  | 2.9383 mL  |
|      | 30 mM            | 0.0979 mL | 0.4897 mL  | 0.9794 mL  | 2.4486 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0735 mL | 0.3673 mL  | 0.7346 mL  | 1.8365 mL  |
|      | 50 mM            | 0.0588 mL | 0.2938 mL  | 0.5877 mL  | 1.4692 mL  |
|      | 60 mM            | 0.0490 mL | 0.2449 mL  | 0.4897 mL  | 1.2243 mL  |
|      | 80 mM            | 0.0367 mL | 0.1836 mL  | 0.3673 mL  | 0.9182 mL  |
|      | 100 mM           | 0.0294 mL | 0.1469 mL  | 0.2938 mL  | 0.7346 mL  |