



CAS 号: 2436760-76-6

产品货号: V46273

生物活性:

Description	ZK824859 hydrochloride 是一种口服有效的选择性尿激酶型纤溶酶原激活剂 (uPA) 抑制剂，用于人 uPA, tPA 和纤溶酶, IC50 分别为 79 nM, 1580 nM 和 1330 nM。				
IC50 & Target	IC50: 79 nM (human uPA), 1580 nM (human tPA), 1330 nM (human plasmin)[1].				
In Vitro	ZK824859 的效力降低了 5 倍并且在小鼠中失去了选择性：uPA IC50=410 nM；tPA IC50=910 nM；与人 IC50 值分别为 79 nM、1580 nM 和 1330 nM 相比，纤溶酶 IC50=1600 nM[1]。				
In Vivo	ZK824859 (50、25 和 10 mg/kg；bid；25 天) 用于慢性小鼠 EAE 模型。ZK 824859 完全防止疾病的发展。然而，两个较低的剂量 (25 和 10 mg/kg) 对临床评分没有影响[1]。				
	Animal Model:	Female SJL mice with chronic mouse EAE model[1]			
	Dosage:	50, 25 and 10 mg/kg			
	Administration:	B.i.d.; 25 days			
	Result:	Prevented the development of disease at 50 mg/kg completely. However, 25 and 10 mg/kg had no effect on clinical scores.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (268.88 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)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1510 mL	10.7552 mL	21.5105 mL
		5 mM	0.4302 mL	2.1510 mL	4.3021 mL
		10 mM	0.2151 mL	1.0755 mL	2.1510 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℃, 6 months; -20℃, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80℃储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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 (4.47 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。					



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: shyyysw@sina.com

	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 (4.47 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.47 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]. Islam I, et al. Discovery of selective urokinase plasminogen activator (uPA) inhibitors as a potential treatment for multiple sclerosis. Bioorg Med Chem Lett. 2018 Nov 1;28(20):3372-3375.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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	2.1510 mL	10.7552 mL	21.5105 mL	53.7762 mL
	5 mM	0.4302 mL	2.1510 mL	4.3021 mL	10.7552 mL
	10 mM	0.2151 mL	1.0755 mL	2.1510 mL	5.3776 mL
	15 mM	0.1434 mL	0.7170 mL	1.4340 mL	3.5851 mL
	20 mM	0.1076 mL	0.5378 mL	1.0755 mL	2.6888 mL
	25 mM	0.0860 mL	0.4302 mL	0.8604 mL	2.1510 mL
	30 mM	0.0717 mL	0.3585 mL	0.7170 mL	1.7925 mL
	40 mM	0.0538 mL	0.2689 mL	0.5378 mL	1.3444 mL
	50 mM	0.0430 mL	0.2151 mL	0.4302 mL	1.0755 mL
	60 mM	0.0359 mL	0.1793 mL	0.3585 mL	0.8963 mL
	80 mM	0.0269 mL	0.1344 mL	0.2689 mL	0.6722 mL
	100 mM	0.0215 mL	0.1076 mL	0.2151 mL	0.5378 mL