



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: shyysw@sina.com

产品名称: Encequidar mesylate

CAS 号: 849675-87-2

产品货号: S89316

生物活性:				
Description	Encequidar mesylate (HM30181 mesylate; HM30181A mesylate) 是 P-糖蛋白 (P-glycoprotein) 的有效竞争性抑制剂。			
IC50 & Target	P-glycoprotein[1][2].			
In Vitro	在 100 nM 和 1000 nM NSC 125973 处理下, 0.1 或 1 nM Encequidar (HM30181) 分别导致 20% 和 42% 的存活抑制[2]。			
In Vivo	Encequidar (HM30181) 与微胶囊同时给药的血浆浓度高于粉末; 提供 1 到 2 小时的显著差异。与粉末相比, 微胶囊的 T _{max} 快约 1.7 倍, AUC 值高 1.6 倍 (2.5±0.6 vs. 4.3±0.9 h; 107.7±20.1 vs. 64.3±18.0 hng/ mL)。微胶囊形式的 Encequidar (HM30181) 的吸收速度更快和整体改善可能是由于其结晶转化为无定形形式和粒径减小导致水溶度和溶解度显著增强[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (31.85 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	1.2742 mL	6.3708 mL
		5 mM	0.2548 mL	1.2742 mL
		10 mM	0.1274 mL	0.6371 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 (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。 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (3.19 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。			
参考文献	[1]. Kim JC, et al. Effect of HM30181 mesylate salt-loaded microcapsules on the oral absorption of NSC 125973 as a novel P-glycoprotein inhibitor. Int J Pharm. 2016 Jun 15;506(1-2):93-101. [2]. Joo KM, et al. Response of brain specific microenvironment to P-glycoprotein inhibitor: an important factor determining therapeutic effect of P-glycoprotein inhibitor on brain metastatic tumors. Int J Oncol. 2008			



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

Oct;33(4):705-12.

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	1.2742 mL	6.3708 mL	12.7416 mL	31.8540 mL
	5 mM	0.2548 mL	1.2742 mL	2.5483 mL	6.3708 mL
	10 mM	0.1274 mL	0.6371 mL	1.2742 mL	3.1854 mL
	15 mM	0.0849 mL	0.4247 mL	0.8494 mL	2.1236 mL
	20 mM	0.0637 mL	0.3185 mL	0.6371 mL	1.5927 mL
	25 mM	0.0510 mL	0.2548 mL	0.5097 mL	1.2742 mL
	30 mM	0.0425 mL	0.2124 mL	0.4247 mL	1.0618 mL