



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: **Enzalutamide Carboxylic Acid Metabolite (M1)**
CAS 号: **1242137-15-0**
产品货号: **S89474**

生物活性:

Description	Enzalutamide carboxylic acid (MDV3100 carboxylic acid) 是 Enzalutamide (MDV3100) 的非活性代谢产物。Enzalutamide 是雄激素受体 (AR) 拮抗剂。			
In Vitro	Enzalutamide 分别通过细胞色素 P450 (CYP) 3A4/5 和 CYP2C8 转化为其主要代谢物, N-去甲基恩杂鲁胺和羧酸恩杂鲁胺。N-desmethyl enzalutamide 具有与 enzalutamide 相似的临床相关抗雄激素能力, 而羧酸 enzalutamide 没有活性[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (276.92 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		2.2154 mL	11.0769 mL
	5 mM		0.4431 mL	2.2154 mL
	10 mM		0.2215 mL	1.1077 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 (4.61 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 (4.61 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。				



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

	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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.61 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]. van Nuland M, et al. Exposure-Response Assessment of Enzalutamide and Its Major Metabolites in a Real-World Cohort of Patients with Metastatic Castration-Resistant Prostate Cancer. Pharmacotherapy. 2019 Dec;39(12):1137-1145.

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	2.2154 mL	11.0769 mL	22.1538 mL	55.3845 mL
	5 mM	0.4431 mL	2.2154 mL	4.4308 mL	11.0769 mL
	10 mM	0.2215 mL	1.1077 mL	2.2154 mL	5.5384 mL
	15 mM	0.1477 mL	0.7385 mL	1.4769 mL	3.6923 mL
	20 mM	0.1108 mL	0.5538 mL	1.1077 mL	2.7692 mL
	25 mM	0.0886 mL	0.4431 mL	0.8862 mL	2.2154 mL
	30 mM	0.0738 mL	0.3692 mL	0.7385 mL	1.8461 mL
	40 mM	0.0554 mL	0.2769 mL	0.5538 mL	1.3846 mL
	50 mM	0.0443 mL	0.2215 mL	0.4431 mL	1.1077 mL
	60 mM	0.0369 mL	0.1846 mL	0.3692 mL	0.9231 mL
	80 mM	0.0277 mL	0.1385 mL	0.2769 mL	0.6923 mL
	100 mM	0.0222 mL	0.1108 mL	0.2215 mL	0.5538 mL