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：Gemcitabine (elaidate)
产品别名：反油酸吉西他滨；CP-4126; CO-101; Gemcitabine 5'-elaidate

生物活性：

Description

Gemcitabine elaidate(CP-4126; CO-101) is a lipophilic, unsaturated fatty acid ester derivative of gemcitabine (dFdC), an antimetabolite deoxynucleoside analogue, with potential antineoplastic activity. IC50 value: Target: Gemcitabine analog Upon hydrolysis intracellularly by esterases, the prodrug gemcitabine is converted into the active metabolites difluorodeoxycytidine di- and tri-phosphate (dFdCDP and dFdCTP) by deoxycytidine kinase. dFdCDP inhibits ribonucleotide reductase, thereby decreasing the deoxynucleotide pool available for DNA synthesis; dFdCTP is incorporated into DNA, resulting in DNA strand termination and apoptosis. Due to its lipophilicity, gemcitabine 5'-elaidic acid ester exhibits an increased cellular uptake and accumulation, resulting in an increased conversion to active metabolites, compared to gemcitabine. In addition, this formulation of gemcitabine may be less susceptible to deamination and deactivation by deoxycytidine deaminase. Check for active clinical trials or closed clinical trials using this agent.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 26 mg/mL (49.28 mM)

H_2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.8952 mL	9.4762 mL	18.9523 mL
	5 mM	0.3790 mL	1.8952 mL	3.7905 mL
	10 mM	0.1895 mL	0.9476 mL	1.8952 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.74 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.74 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

	Solubility: 2.5 mg/mL (4.74 mM); Suspended solution; Need ultrasonic 此方案可获得 2.5 mg/mL (4.74 mM)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。 3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.74 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.74 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 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 玉米油中，混合均匀。