

产品名称：噻克索酮  
产品别名：Tioxolone

生物活性：

Description

Tioxolone, a metalloenzyme carbonic anhydrase I inhibitor, is an anti-acne preparation. Target: Carbonic Anhydrase Tioxolone is a metalloenzyme carbonic anhydrase I inhibitor with a  $K_i$  of 91 nM. Tioxolone lacks sulfonamide, sulfamate, or hydroxamate functional groups that are typically found in therapeutic carbonic anhydrase (CA) inhibitors, such as acetazolamide. Tioxolone is proposed to be a prodrug inhibitor that is cleaved via a CA II zinc-hydroxide mechanism known to catalyze the hydrolysis of esters. When tioxolone binds in the active site of CA II, it is cleaved and forms 4-mercaptobenzene-1,3-diol via the intermediate S-(2,4-thiophenyl) hydrogen thiocarbonate. The esterase cleavage product binds to the zinc active site via the thiol group and is therefore the active CA inhibitor, while the intermediate is located at the rim of the active-site cavity. From Wikipedia.

**In Vitro:**

DMSO :  $\geq 100$  mg/mL (594.64 mM)

H<sub>2</sub>O : 0.67 mg/mL (3.98 mM; Need ultrasonic)

\* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing  Stock Solutions	Solvent	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	Concentration				
		1 mM	5.9464 mL	29.7318 mL	59.4636 mL
		5 mM	1.1893 mL	5.9464 mL	11.8927 mL
		10 mM	0.5946 mL	2.9732 mL	5.9464 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。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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:  $\geq 2.5$  mg/mL (14.87 mM); Clear solution

此方案可获得  $\geq 2.5$  mg/mL (14.87 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

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

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

Solubility:  $\geq 2.5$  mg/mL (14.87 mM); Clear solution

此方案可获得  $\geq 2.5$  mg/mL (14.87 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100  $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900  $\mu$ L 20% 的 SBE- $\beta$ -CD 生理盐水溶液中，混合均匀。

	<p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (14.87 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> mg/mL (14.87 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 <math>\mu</math>L 25.0 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>
References	[1]. <a href="http://en.wikipedia.org/wiki/Tioxolone">http://en.wikipedia.org/wiki/Tioxolone</a>



源叶生物