



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: Tafamidis

产品别名: 氯苯唑酸

生物活性:

| Description | Tafamidis is a potent and selective transthyretin (TTR) stabilizer, shows comparable potency and efficacy to the mutant homotetramers V30M-TTR, V122I-TTR and wild type WT-TTR, with EC50s of 2.7-3.2 μ M. Tafamidis inhibits amyloidogenesis[1]. | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
|---------------------------|---|-----------|------------|------------|---------------------------|------------------------------|------|------|-------|------|-----------|------------|------------|------|-----------|-----------|-----------|-------|-----------|-----------|-----------|
| IC ₅₀ & Target | EC50: 2.7-3.2 μ M (TTR)[1] | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| In Vitro | Tafamidis binds selectively and with negative cooperativity (K_{ds} ~2 nM and ~200 nM) to the two normally unoccupied thyroxine-binding sites of the tetramer, and kinetically stabilizes TTR[1]. Tafamidis (0-7.2 μ M) dose-dependently inhibits WT-TTR amyloidogenesis after treatment for 72 hours at a pH of 4.4-4.5[1]. | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Solvent&Solubility | <p>In Vitro:</p> <p>DMSO : 37.5 mg/mL (121.71 mM; Need ultrasonic)</p> <p>H₂O : < 0.1 mg/mL (insoluble)</p> <table border="1"><thead><tr><th rowspan="2">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent / Mass Concentration</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr></thead><tbody><tr><td>1 mM</td><td>3.2455 mL</td><td>16.2274 mL</td><td>32.4549 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.6491 mL</td><td>3.2455 mL</td><td>6.4910 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.3245 mL</td><td>1.6227 mL</td><td>3.2455 mL</td></tr></tbody></table> <p>*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。</p> <p>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。</p> <p>In Vivo:</p> <p>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：</p> <p>——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</p> <p>1. 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% saline</p> <p>Solubility: 2.5 mg/mL (8.11 mM); Suspended solution; Need ultrasonic</p> <p>此方案可获得 2.5 mg/mL (8.11 mM) 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p> <p>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。</p> <p>2. 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in saline)</p> <p>Solubility: 2.5 mg/mL (8.11 mM); Suspended solution; Need ultrasonic</p> <p>此方案可获得 2.5 mg/mL (8.11 mM) 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p> <p>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 生理盐水溶液中，混合均匀。</p> | | | | Preparing Stock Solutions | Solvent / Mass Concentration | 1 mg | 5 mg | 10 mg | 1 mM | 3.2455 mL | 16.2274 mL | 32.4549 mL | 5 mM | 0.6491 mL | 3.2455 mL | 6.4910 mL | 10 mM | 0.3245 mL | 1.6227 mL | 3.2455 mL |
| Preparing Stock Solutions | Solvent / Mass Concentration | 1 mg | 5 mg | 10 mg | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| | 1 mM | 3.2455 mL | 16.2274 mL | 32.4549 mL | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 5 mM | 0.6491 mL | 3.2455 mL | 6.4910 mL | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 10 mM | 0.3245 mL | 1.6227 mL | 3.2455 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: shyysw@sina.com

| | |
|-------------------|---|
| | <p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.11 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.11 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。</p> |
| References | [1]. Bulawa, C.E., et al., Tafamidis, a potent and selective transthyretin kinetic stabilizer that inhibits the amyloid cascade. Proc Natl Acad Sci U S A, 2012. 109(24): p. 9629-34. |



源叶生物