



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: **CSF1R-IN-1**
CAS 号: **2095849-04-8**
产品货号: **S23221**

生物活性:

Description	CSF1R-IN-1 是 CSF1R 的抑制剂, IC50 为 0.5 nM.				
In Vivo	CSF1R-IN-1 has favorable pharmacokinetics when dosed orally to mice. It appears suitable for in vivo pharmacology testing in the appropriate preclinical tumor model to demonstrate proof of concept.[1].				
	Animal Model:	Male CD-1 mice, 25-35 grams (8-11 weeks old)[1]			
	Dosage:	2 mg/kg IV or 10 mg/kg orally (Per Os)			
	Administration:	i.v. or oral			
	Result:	I.V.: Cmax=3.55, T1/2=0.87 P.O.: Cmax=4.6, T1/2=1.8, Bioavailability=64%.			
In Vitro	CSF1R is thought to play an important role in recruitment and differentiation of tumor-associated macrophages (TAMs). CSF1R-IN-1 (compound 22) shows good intestinal permeability in a Caco2 assay[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (173.80 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	2.0857 mL	10.4286 mL	20.8572 mL
		5 mM	0.4171 mL	2.0857 mL	4.1714 mL
		10 mM	0.2086 mL	1.0429 mL	2.0857 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 (4.34 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。					



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

	方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (4.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (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。
References	[1]. Ramachandran SA, et al. Design, synthesis and optimization of bis-amide derivatives as CSF1R inhibitors. Bioorg Med Chem Lett. 2017 May 15;27(10):2153-2160.

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	2.0857 mL	10.4286 mL	20.8572 mL	52.1431 mL
	5 mM	0.4171 mL	2.0857 mL	4.1714 mL	10.4286 mL
	10 mM	0.2086 mL	1.0429 mL	2.0857 mL	5.2143 mL
	15 mM	0.1390 mL	0.6952 mL	1.3905 mL	3.4762 mL
	20 mM	0.1043 mL	0.5214 mL	1.0429 mL	2.6072 mL
	25 mM	0.0834 mL	0.4171 mL	0.8343 mL	2.0857 mL
	30 mM	0.0695 mL	0.3476 mL	0.6952 mL	1.7381 mL
	40 mM	0.0521 mL	0.2607 mL	0.5214 mL	1.3036 mL
	50 mM	0.0417 mL	0.2086 mL	0.4171 mL	1.0429 mL
	60 mM	0.0348 mL	0.1738 mL	0.3476 mL	0.8691 mL
	80 mM	0.0261 mL	0.1304 mL	0.2607 mL	0.6518 mL
	100 mM	0.0209 mL	0.1043 mL	0.2086 mL	0.5214 mL