



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: **BMS-986205**

CAS 号: **1923833-60-6**

产品货号: **S87963**

生物活性:					
Description	Linrodostat (BMS-986205) 是一种选择性的不可逆的吡啶胺 2,3-双加氧酶 1 (IDO1) 抑制剂, 对 IDO1-HEK293 细胞具有有效的抑制作用, 其 IC50 值为 1.1 nM。Linrodostat 在晚期癌症中具有良好的药理活性。				
IC50 & Target[1]	IDO1 1.1 nM (IC50)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HeLa	IC50	2.8 nM	Inhibition of IDO1 in IFN-gamma stimulated human HeLa cells using L-tryptophan as substrate incubated for 48 hrs by fluorescence assay	
In Vitro	Linrodostat (0.01-100 μM; 72 小时; SKOV-3 和 Jurkat 克隆 E6-1 细胞) 处理组与未处理的对照组相比, 活细胞数量减少。Linrodostat 在低得多的浓度下也能诱导细胞死亡, 其 IC50 为 6.3 μM[1]。				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:		SKOV-3 and Jurkat clone E6-1 cells		
	Concentration:		0.01-100 μM		
	Incubation Time:		72 hours		
Solvent&Solubility	Result:		Reduced the number of viable cells compared with the non-treated control and induced cell death at much lower concentrations.		
	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (121.68 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	2.4336 mL	12.1681 mL	24.3362 mL
5 mM		0.4867 mL	2.4336 mL	4.8672 mL	
10 mM		0.2434 mL	1.2168 mL	2.4336 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。					
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: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline					



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: shyyysw@sina.com

	Solubility: 2.5 mg/mL (6.08 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂： 5% DMSO → 95% (20% SBE- β -CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.08 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.06 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μ L 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 ddH₂ O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 四 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE- β -CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (5.06 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 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 五 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.06 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Richards T, et al. Cell based functional assays for IDO1 inhibitor screening and characterization. Oncotarget. 2018 Jul 20;9(56):30814-30820. [2]. Lillian L. Siu, et al. Abstract CT116: BMS-986205, an optimized indoleamine 2,3-dioxygenase 1 (IDO1) inhibitor, is well tolerated with potent pharmacodynamic (PD) activity, alone and in combination with nivolumab (nivo) in advanced cancers in a phase 1/2a trial. AACR; Cancer Res. 2017; 77 (13 Suppl): Abstract nr CT116.

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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4336 mL	12.1681 mL	24.3362 mL	60.8406 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: shyyssw@sina.com

	5 mM	0.4867 mL	2.4336 mL	4.8672 mL	12.1681 mL
	10 mM	0.2434 mL	1.2168 mL	2.4336 mL	6.0841 mL
	15 mM	0.1622 mL	0.8112 mL	1.6224 mL	4.0560 mL
	20 mM	0.1217 mL	0.6084 mL	1.2168 mL	3.0420 mL
	25 mM	0.0973 mL	0.4867 mL	0.9734 mL	2.4336 mL
	30 mM	0.0811 mL	0.4056 mL	0.8112 mL	2.0280 mL
	40 mM	0.0608 mL	0.3042 mL	0.6084 mL	1.5210 mL
	50 mM	0.0487 mL	0.2434 mL	0.4867 mL	1.2168 mL
	60 mM	0.0406 mL	0.2028 mL	0.4056 mL	1.0140 mL
	80 mM	0.0304 mL	0.1521 mL	0.3042 mL	0.7605 mL
	100 mM	0.0243 mL	0.1217 mL	0.2434 mL	0.6084 mL

