



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: **Cilofexor**
CAS 号: **1418274-28-8**
产品货号: **S88391**

生物活性:

Description	Cilofexor (GS-9674) 是一种有效的, 选择性的, 口服活性的非甾体 FXR 激动剂, EC50 为 43 nM。Cilofexor 具有抗炎和抗纤维化作用。Cilofexor 可用于原发性硬化性胆管炎 (PSC) 和非酒精性脂肪性肝炎 (NASH) 的研究。				
IC50 & Target	EC50: 43 nM (FXR)[1]				
In Vitro	在非酒精性脂肪性肝炎 (NASH) 大鼠中, Cilofexor (GS-9674; 30 mg/kg; 口服强饲法; 每天一次; 持续 10 周; 雄性 Wistar 大鼠) 处理显著增加回肠中的 Fgf15 表达并降低肝脏中的 Cyp7a1。肝纤维化和肝胶原表达明显减少。Cilofexor 还可以显著降低肝星状细胞 (HSC) 的活化并显著降低门静脉压力, 而不影响全身血流动力学[3]。				
	Animal Model:	Male Wistar rats received a choline-deficient high fat diet (CDHFD)[3]			
	Dosage:	30 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; once daily; for 10 weeks			
	Result:	Significantly increased Fgf15 expression in the ileum and decreased Cyp7a1 in the liver. Liver fibrosis and hepatic collagen expression were significantly reduced.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (85.20 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	1.7040 mL	8.5201 mL	17.0401 mL
		5 mM	0.3408 mL	1.7040 mL	3.4080 mL
		10 mM	0.1704 mL	0.8520 mL	1.7040 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: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.54 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.54 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 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Trauner M, et al. The Nonsteroidal Farnesoid X Receptor Agonist Cilofexor (GS-9674) Improves Markers of Cholestasis and Liver Injury in Patients With Primary Sclerosing Cholangitis. Hepatology. 2019 Sep;70(3):788-801. [2]. Patel K, et al. Cilofexor, a Nonsteroidal FXR Agonist, in Non-Cirrhotic Patients with Nonalcoholic Steatohepatitis: A Phase 2 Randomized Controlled Trial. Hepatology. 2020 Mar 1. [3]. P. Schwab, et al. The FXR agonist GS-9674 reduces fibrosis and portal hypertension in a rat model of NASH. April 2018, Volume 68, Supplement 1, Pages S471-S472.

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	1.7040 mL	8.5201 mL	17.0401 mL	42.6003 mL
	5 mM	0.3408 mL	1.7040 mL	3.4080 mL	8.5201 mL
	10 mM	0.1704 mL	0.8520 mL	1.7040 mL	4.2600 mL
	15 mM	0.1136 mL	0.5680 mL	1.1360 mL	2.8400 mL
	20 mM	0.0852 mL	0.4260 mL	0.8520 mL	2.1300 mL
	25 mM	0.0682 mL	0.3408 mL	0.6816 mL	1.7040 mL
	30 mM	0.0568 mL	0.2840 mL	0.5680 mL	1.4200 mL
	40 mM	0.0426 mL	0.2130 mL	0.4260 mL	1.0650 mL
	50 mM	0.0341 mL	0.1704 mL	0.3408 mL	0.8520 mL
	60 mM	0.0284 mL	0.1420 mL	0.2840 mL	0.7100 mL
	80 mM	0.0213 mL	0.1065 mL	0.2130 mL	0.5325 mL