



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **IDF-11774**  
CAS 号: **1429054-28-3**  
产品货号: **S88394**

|                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                   |             |             |
|-------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------|-------------|-------------|
| <b>生物活性:</b>                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                   |             |             |
| <b>Description</b>                  | IDF-11774 是一种新型低氧诱导因子 $\alpha$ (HIF $\alpha$ )-1 的抑制剂, 其 IC <sub>50</sub> 值为 3.65 $\mu$ M。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                   |             |             |
| <b>IC<sub>50</sub> &amp; Target</b> | IC <sub>50</sub> : 3.65 $\mu$ M (HIF-1 $\alpha$ ) [1]                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                   |             |             |
| <b>In Vitro</b>                     | IDF-11774 是一种新型缺氧诱导因子 (HIF)-1 抑制剂, 在癌细胞系中的 IC <sub>50</sub> 为 3.65 $\mu$ M。IDF-11774 已被批准作为 I 期研究的临床候选药物。用 IDF-11774 处理的人脐带血管内皮细胞 (HUVEC) 在基质胶上显示毛细血管网络形成减少。IDF-11774 处理导致 GLUT1 和丙酮酸脱氢酶激酶 1 (PDK1) 的 mRNA 表达降低。此外, 在 IDF-11774 存在的情况下, 细胞内 ATP 水平显著降低, 并且在低葡萄糖条件下 (5.5 mM) 受到更大程度的影响 [1]。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                   |             |             |
| <b>In Vivo</b>                      | 与对照组相比, 口服 IDF-11774 处理的小鼠肿瘤中荧光素酶活性和 HIF-1 $\alpha$ 积累受到强烈抑制。当每天口服 IDF-11774 持续两周时, 在小鼠模型中观察到显著的剂量依赖性肿瘤消退 [1]。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                   |             |             |
| <b>Solvent&amp;Solubility</b>       | <b>细胞实验:</b><br>DMSO 中的溶解度 : 60 mg/mL (162.82 mM); 超声加热助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                   |             |             |
|                                     | <b>Preparing Stock Solutions</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | <b>Solvent Mass Concentration</b> | <b>1 mg</b> | <b>5 mg</b> |
|                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 1 mM                              | 2.7136 mL   | 13.5682 mL  |
|                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 5 mM                              | 0.5427 mL   | 2.7136 mL   |
|                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 10 mM                             | 0.2714 mL   | 1.3568 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。<br>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。<br><b>动物实验:</b><br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br><b>方案 一</b><br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline<br>Solubility: $\geq$ 1.67 mg/mL (4.53 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq$ 1.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 $\mu$ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 $\mu$ L 生理盐水 定容至 1 mL。<br>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH <sub>2</sub> O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。<br><b>方案 二</b><br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- $\beta$ -CD in Saline)<br>Solubility: $\geq$ 1.67 mg/mL (4.53 mM); 澄清溶液 |                                   |             |             |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>此方案可获得 <math>\geq 1.67 \text{ mg/mL}</math> (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 <math>1 \text{ mL}</math> 工作液为例, 取 <math>100 \mu\text{L}</math> <math>16.7 \text{ mg/mL}</math> 的澄清 DMSO 储备液加到 <math>900 \mu\text{L}</math> 20% 的 SBE-<math>\beta</math>-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>2 g SBE-<math>\beta</math>-CD (磺丁基醚 <math>\beta</math>-环糊精) 粉末定容于 <math>10 \text{ mL}</math> 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: <math>10\% \text{ DMSO} \rightarrow 90\% \text{ Corn Oil}</math></p> <p>Solubility: <math>\geq 1.67 \text{ mg/mL}</math> (4.53 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 1.67 \text{ mg/mL}</math> (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。</p> <p>以 <math>1 \text{ mL}</math> 工作液为例, 取 <math>100 \mu\text{L}</math> <math>16.7 \text{ mg/mL}</math> 的澄清 DMSO 储备液加到 <math>900 \mu\text{L}</math> 玉米油中, 混合均匀。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Ban HS, et al. The novel hypoxia-inducible factor-1<math>\alpha</math> inhibitor IDF-11774 regulates cancer metabolism, thereby suppressing tumor growth. Cell Death Dis. 2017 Jun 1;8(6):e2843.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |

#### 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:  $-80^{\circ} \text{C}$ , 2 years;  $-20^{\circ} \text{C}$ , 1 year.  $-80^{\circ} \text{C}$  储存时, 请在 2 年内使用,  $-20^{\circ} \text{C}$  储存时, 请在 1 年内使用。

| 可选溶剂 | 质量<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 2.7136 mL | 13.5682 mL | 27.1363 mL | 67.8408 mL |
|      | 5 mM             | 0.5427 mL | 2.7136 mL  | 5.4273 mL  | 13.5682 mL |
|      | 10 mM            | 0.2714 mL | 1.3568 mL  | 2.7136 mL  | 6.7841 mL  |
|      | 15 mM            | 0.1809 mL | 0.9045 mL  | 1.8091 mL  | 4.5227 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1357 mL | 0.6784 mL  | 1.3568 mL  | 3.3920 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1085 mL | 0.5427 mL  | 1.0855 mL  | 2.7136 mL  |
|      | 30 mM            | 0.0905 mL | 0.4523 mL  | 0.9045 mL  | 2.2614 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0678 mL | 0.3392 mL  | 0.6784 mL  | 1.6960 mL  |
|      | 50 mM            | 0.0543 mL | 0.2714 mL  | 0.5427 mL  | 1.3568 mL  |
|      | 60 mM            | 0.0452 mL | 0.2261 mL  | 0.4523 mL  | 1.1307 mL  |
|      | 80 mM            | 0.0339 mL | 0.1696 mL  | 0.3392 mL  | 0.8480 mL  |
|      | 100 mM           | 0.0271 mL | 0.1357 mL  | 0.2714 mL  | 0.6784 mL  |