



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: **IACS-10759**

CAS 号: **1570496-34-2**

产品货号: **S88429**

生物活性:				
Description	IACS-010759 是一种口服有效的线粒体氧化磷酸化复合物 I (OXPHOS) 抑制剂。IACS-010759 在依赖 OXPHOS 的脑癌和急性髓性白血病 (AML) 模型中抑制增殖并诱导细胞凋亡。IACS-010759 具有用于复发/难治性 AML 和实体瘤研究的潜力。			
IC50 & Target	OXPHOS[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HCT-116	IC ₅₀	9.63 nM	Antiproliferative activity against human HCT-116 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 96 hrs by MTT assay
	HL-60	EC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human HL-60 cells assessed as cell growth inhibition incubated for 72 hrs by MTT assay
	KG-1	EC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human KG-1 cells assessed as cell growth inhibition incubated for 72 hrs by MTT assay
	KG-1	IC ₅₀	63.84 nM	Antiproliferative activity against human KG-1 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 96 hrs by MTT assay
	NCI-H460	IC ₅₀	1.4 nM	Inhibition of mitochondrial respiration in human NCI-H460 cells assessed as oxygen consumption rate incubated for 1 hr by Seahorse XF24 extracellular flux analyzer
	NCI-H460	IC ₅₀	1.4 nM	Cytotoxicity against human NCI-H460 cells assessed as reduction in galactose-dependent cell viability incubated for 3 days by IncuCyte live-cell imaging assay
	NCM460	IC ₅₀	> 1000 nM	Antiproliferative activity against human NCM460 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 96 hrs by MTT assay
	THP-1	EC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human THP-1 cells assessed as cell growth inhibition incubated for 72 hrs by MTT assay
In Vitro	IACS-010759 (10、30、100 nM; 持续 4 或 5 天) 在原发性 AML[1]中降低活力并诱导细胞凋亡。 IACS-010759 (0.001、0.01、0.1、1、10、100、1000 nM; 72 小时) 强烈抑制 OCR 和半乳糖依赖性 H460 细胞活力, IC₅₀ 值几乎相同, 为 1.4 nM[1]。 IACS-010759 在小鼠 (平均 IC₅₀=5.6 nM)、大鼠 (IC₅₀=12.2 nM) 和食蟹猴 (IC₅₀=8.7 nM) 细胞系[1]中具有相似的活性。 IACS-010759 (0.01-10 μM) 在大多数癌细胞系 (30 种胰腺 (PDAC) 中的 24 种、20 种卵巢中的 19 种、16 种三阴性细胞中的 13 种) 中产生的最大生长减少 > 50%乳腺癌 (TNBC)、10 例非小细胞肺癌 (NSCLC) 中的 8 例) 和一个子集 (30 例 PDAC 中的 11 例、20 例卵巢中的 10 例、16 例 TNBC 中的 5 例、10 例 NSCLC 中的 2 例) 表现出 > 100% 的生长抑制[1]。			
In Vivo	IACS-010759 (5、10、25 mg/kg/天; 口服; 持续 21 天) 在携带 NB-1 (PGD 无效) 的小鼠中以 5 或 10 mg/kg 剂量导致肿瘤消退, 体重减轻最小皮下异种移植物。不能耐受 25 mg/kg 剂量的 IACS-010759[1]。 IACS-010759 HCl (10 mg/kg; 口服; QD (每日) 或 QD×5 (开 5 天/停 2 天); 持续 35 天) 将中			



	位生存期从 28 天延长至超过 60 天, 而较低频率的给药方案 (Q2D 或 Q3D) 可在较小程度上提高生存率[1]。 IACS-010759 (静脉注射 0.3 mg/kg; 口服 1 mg/kg) 具有低血浆清除率和高分布容积, 导致终末半衰期延长 (>24 小时)[1]。	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (88.88 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)	
	<table><tr><td rowspan="4">Preparing <</td></tr></table>	Preparing <
	Preparing <	



Suppl):Abstract nr 4380. doi:10.1158/1538-7445.AM2015-4380.

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, 1 year; -20° C, 6 months。 -80° C 储存时,请在 1 年内使用, -20° C 储存时,请在 6 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	1.7776 mL	8.8879 mL	17.7759 mL	44.4397 mL
	5 mM	0.3555 mL	1.7776 mL	3.5552 mL	8.8879 mL
	10 mM	0.1778 mL	0.8888 mL	1.7776 mL	4.4440 mL
	15 mM	0.1185 mL	0.5925 mL	1.1851 mL	2.9626 mL
	20 mM	0.0889 mL	0.4444 mL	0.8888 mL	2.2220 mL
	25 mM	0.0711 mL	0.3555 mL	0.7110 mL	1.7776 mL
	30 mM	0.0593 mL	0.2963 mL	0.5925 mL	1.4813 mL
	40 mM	0.0444 mL	0.2222 mL	0.4444 mL	1.1110 mL
	50 mM	0.0356 mL	0.1778 mL	0.3555 mL	0.8888 mL
	60 mM	0.0296 mL	0.1481 mL	0.2963 mL	0.7407 mL
	80 mM	0.0222 mL	0.1111 mL	0.2222 mL	0.5555 mL