



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-1166**
CAS 号: **1818314-88-3**
产品货号: **S88512**

生物活性:

Description	BMS-1166 是一种有效的 PD-1/PD-L1 免疫检查点抑制剂。BMS-1166 诱导 PD-L1 二聚化并阻断其与 PD-1 的相互作用, IC50 为 1.4 nM。BMS-1166 拮抗 PD-1/PD-L1 免疫检查点对 T 细胞活化的抑制作用。				
IC50 & Target	IC50: 1.4 nM (PD-1/PD-L1 interaction)[1].				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	B16-F10	DC ₅₀	0.39 μM	Antiproliferative activity against mouse B16-F10 cells assessed as reduction in cell growth	
	CHO	GI ₅₀	> 30 μM	Growth inhibition of CHO cells expressing PDL-1/TCRa incubated for 24 hrs by Cell Titer-Glo luminescent cell viability assay	
	CHO	GI ₅₀	> 30 μM	Growth inhibition of CHO cells expressing PDL-1/TCRa measured after 24 hrs co-culturing with human Jurkat cells expressing PD-1/NFAT-Luc in presence of compound by Cell Titer-Glo luminescent cell viability assay	
	CT26	DC ₅₀	0.35 μM	Antiproliferative activity against mouse CT26 cells assessed as reduction in cell viability	
	Jurkat	EC ₅₀	1578 nM	Inhibition of interaction of human PD-1 expressed in Jurkat T cells co-transfected with NFAT response element/human PD-L1 expressed in CHO-K1 cells co-expressing cell surface protein and TCR ligand preincubated with CHO-K1 cells followed by Jurkat cell addition and measured after 6 hrs by Bio-Glo reagent based luminescence microplate reader analysis	
	Jurkat	IC ₅₀	0.1 nM	Cytotoxicity against human Jurkat T cells assessed as reduction in cell viability	
In Vitro	BMS-1166 是一种强效的 PD-1/PD-L1 相互作用抑制剂, 在均相时间分辨荧光结合试验中 IC50 为 1.4 nM[1]。 BMS-1166 可拮抗 PD-1/PD-L1 免疫检查点对 T 细胞活化的抑制作用。BMS-1166 以剂量依赖性的方式消除 sPD-L1 对内皮细胞 (EC) 刺激的抑制作用[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (194.97 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	1.5598 mL	7.7990 mL	15.5979 mL
		5 mM	0.3120 mL	1.5598 mL	3.1196 mL
10 mM		0.1560 mL	0.7799 mL	1.5598 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 (3.24 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.24 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 900 μL 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.24 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]. Guzik K, et al. Small-Molecule Inhibitors of the Programmed Cell Death-1/Programmed Death-Ligand 1 (PD-1/PD-L1) Interaction via Transiently Induced Protein States and Dimerization of PD-L1. J Med Chem. 2017 Jul 13;60(13):5857-5867. [2]. Skalniak L, et al. Small-molecule inhibitors of PD-1/PD-L1 immune checkpoint alleviate the PD-L1-induced exhaustion of T-cells. Oncotarget. 2017 Aug 7;8(42):72167-72181.
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。	



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: shyyw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.5598 mL	7.7990 mL	15.5979 mL	38.9949 mL
	5 mM	0.3120 mL	1.5598 mL	3.1196 mL	7.7990 mL
	10 mM	0.1560 mL	0.7799 mL	1.5598 mL	3.8995 mL
	15 mM	0.1040 mL	0.5199 mL	1.0399 mL	2.5997 mL
	20 mM	0.0780 mL	0.3899 mL	0.7799 mL	1.9497 mL
	25 mM	0.0624 mL	0.3120 mL	0.6239 mL	1.5598 mL
	30 mM	0.0520 mL	0.2600 mL	0.5199 mL	1.2998 mL
	40 mM	0.0390 mL	0.1950 mL	0.3899 mL	0.9749 mL
	50 mM	0.0312 mL	0.1560 mL	0.3120 mL	0.7799 mL
	60 mM	0.0260 mL	0.1300 mL	0.2600 mL	0.6499 mL
	80 mM	0.0195 mL	0.0975 mL	0.1950 mL	0.4874 mL
	100 mM	0.0156 mL	0.0780 mL	0.1560 mL	0.3899 mL

源叶