



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: 培西达替尼盐酸盐; **Pexidartinib HCl**

CAS 号: **2040295-03-0**

产品编号: **S89653**

生物活性:

Description	Pexidartinib hydrochloride (PLX-3397 hydrochloride) 是一种有效、具有口服活性的, 选择性 ATP-竞争性的集落刺激因子 1 (CSF1R 或 M-CSFR) 和 c-Kit 抑制剂, IC50 值分别为 20 和 10 nM。Pexidartinib hydrochloride 对 c-Kit 和 CSF1R 的选择性是对其他相关激酶的 10-100 倍, 例如 FLT3, KDR (VEGFR2), LCK, FLT1 (VEGFR1) 和 NTRK3 (TRKC), IC50 值分别为 160, 350, 860, 880 和 890 nM。Pexidartinib hydrochloride 可以诱导细胞凋亡 (apoptosis) 具有抗肿瘤活性。	
IC50 & Target	IC50: CSF1R (cFMS) 20 nM, c-Kit 10 nM, FLT3 160 nM, KDR (VEGFR2) 350 nM, LCK 860 nM, FLT1 (VEGFR1) 880 nM, NTRK3 (TRKC) 890 nM	
In Vitro	Pexidartinib hydrochloride (PLX-3397 hydrochloride) 是一种高效、选择性且具有 ATP 竞争性的 CSF1R (cFMS) 和 c-Kit 抑制剂, 对 c-Kit 和 CSF1R 的选择性比其他相关激酶 (如 FLT3、KDR (VEGFR2)、LCK、FLT1 (VEGFR1) 和 NTRK3 (TRKC)) 高 10 到 100 倍, 其对这些激酶的 IC50 分别为 160 nM、350 nM、860 nM、880 nM 和 890 nM[1]。	
In Vivo	Pexidartinib hydrochloride 可用于耗竭小鼠的小胶质细胞。	
	Pexidartinib (在 AIN - 76A 标准饲料中含量为 290 ppm, 持续 21 天) hydrochloride 可使成年雄性 C57BL/6J 小鼠 (20-25 g) 大脑中小胶质细胞减少 70%[5]。	
	Pexidartinib (在饲料中含量为 600 ppm, 持续 10 天和 30 天) hydrochloride 可使 C57BL/6J 小鼠大脑中小胶质细胞减少超过 90%[6]。	
	Pexidartinib (0.25、1 mg/kg, 腹腔注射, 每天两次, 持续 8 天) hydrochloride 抑制新生小鼠中小胶质细胞和 BrdU 阳性细胞的增殖[2]。	
	Pexidartinib (1 mg/kg, 每天两次, 持续 8 天) hydrochloride 对小鼠中裂解的 caspase-3 阳性细胞无明显影响[2]。	
	Pexidartinib (50 mg/kg; 口服; 每两天一次, 持续 3 周) hydrochloride 可降低小鼠组织中巨噬细胞水平, 而不影响葡萄糖稳态[4]。Pexidartinib hydrochloride 主要通过 ABCB1 具有血脑屏障透过性, 且透过性有限[7]。	
	Pexidartinib hydrochloride 主要能透过肿瘤周围被破坏的血脑屏障, 使肿瘤细胞能够进入完整的血脑屏障内[8]。	
	Animal Model:	Neonatal mice[2]
	Dosage:	0.25, 1 mg/kg
	Administration:	I.P. twice daily for 8 days
	Result:	Decreased the number of microglia and BrdU-positive proliferative cells, but did not change the cleaved caspase-3-positive cells.
	Animal Model:	10-week old litter mate C57BL/6 mice (chow and high-fat diet fed mice)[4]
	Dosage:	50mg/kg
	Administration:	P.o.; every second day for 3 weeks
	Result:	Substantially reduced macrophage numbers in adipose tissue of both chow and high-fat diet fed mice without affecting total myeloid cell levels.
Solvent&Solubility	细胞实验:	



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

DMSO 中的溶解度 : 60 mg/mL (132.08 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)				
H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.2013 mL	11.0064 mL	22.0129 mL
	5 mM	0.4403 mL	2.2013 mL	4.4026 mL
	10 mM	0.2201 mL	1.1006 mL	2.2013 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, 1 year; -20°C, 6 months (sealed storage, away from moisture)。-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。 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 µL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 µL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 µL 玉米油中, 混合均匀。 方案 四				



	请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 mM); 澄清溶液 方案 五 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 mM); 澄清溶液
参考文献	[1]. DeNardo DG, et al. Leukocyte complexity predicts breast cancer survival and functionally regulates response to chemotherapy. Cancer Discov. 2011 Jun;1(1):54-67. [2]. Kuse Y, et al. Microglia increases the proliferation of retinal precursor cells during postnatal development. Mol Vis. 2018 Jul 30;24:536-545. eCollection 2018. [3]. Lee JH, et al. A phase I study of pexidartinib, a colony-stimulating factor 1 receptor inhibitor, in Asian patients with advanced solid tumors. Invest New Drugs. 2019 Mar 2. [4]. Merry TL, et al. The CSF1 receptor inhibitor pexidartinib (PLX3397) reduces tissue macrophage levels without affecting glucose homeostasis in mice. Int J Obes (Lond). 2020;44(1):245-253. [5]. Luo L, et al. Intermittent theta-burst stimulation improves motor function by inhibiting neuronal pyroptosis and regulating microglial polarization via TLR4/NFκB/NLRP3 signaling pathway in cerebral ischemic mice. J Neuroinflammation. 2022 Jun 11;19(1):141. [6]. Chadarevian JP, et al. Engineering an inhibitor-resistant human CSF1R variant for microglia replacement. J Exp Med. 2023 Mar 6;220(3):e20220857.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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	2.2013 mL	11.0064 mL	22.0129 mL	55.0321 mL
	5 mM	0.4403 mL	2.2013 mL	4.4026 mL	11.0064 mL
	10 mM	0.2201 mL	1.1006 mL	2.2013 mL	5.5032 mL
	15 mM	0.1468 mL	0.7338 mL	1.4675 mL	3.6688 mL
	20 mM	0.1101 mL	0.5503 mL	1.1006 mL	2.7516 mL
	25 mM	0.0881 mL	0.4403 mL	0.8805 mL	2.2013 mL
	30 mM	0.0734 mL	0.3669 mL	0.7338 mL	1.8344 mL
	40 mM	0.0550 mL	0.2752 mL	0.5503 mL	1.3758 mL
	50 mM	0.0440 mL	0.2201 mL	0.4403 mL	1.1006 mL
	60 mM	0.0367 mL	0.1834 mL	0.3669 mL	0.9172 mL
	80 mM	0.0275 mL	0.1376 mL	0.2752 mL	0.6879 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: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0220 mL	0.1101 mL	0.2201 mL	0.5503 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶