



CAS 号: 639858-32-5

产品货号: S89777

生物活性:

Description

BMS-605541 is a selective and orally active inhibitor of VEGFR-2 kinase with an IC50 value of 23 nM and Ki value of 49 nM. BMS-605541 inhibits the activity of Flk-1, VEGFR-1 and PDGFR-β with IC50 values of 40 nM, 400 nM and 200 nM, respectively. BMS-605541 can be used for cancer research[1].

IC50 & Target

VEGFR-2

23 nM (IC50)

VEGFR-2

49 nM (Ki)

Flk-1

40 nM (IC50)

VEGFR-1

400 nM (IC50)

PDGFR-β

200 nM (IC50)

In Vitro

BMS-605541 (Compound 14) 通过 VEGF 抑制 HUVECs 的生长, IC50 值为 25 nM[1]。

In Vivo

BMS-605541 (12.5-180 mg/kg; 一天 1 次或一天 2 次, 持续 14 天) 对皮下植入 L2987 和 HCT-116 异种移植物的无胸腺小鼠具有抗肿瘤活性[1]。

BMS-605541 的药代动力学 (PK) 参数[1]

Admini						Cl				
stration	Dose	Cmax	AUC	MRT	(mL/mi	Vss				
Species	manner	(mg/kg)	(μM)	Tmax (h)	(μM·h)	T1/2 (h)	(h)	n·kg)	Fpo (%)	
Oral				649						
Mouse	gavage	90	148	0.5	(0-24 h)	1.7	3.4		100	
Intraven										
ous										
Mouse	injection	10						11.8	1.7	100
Oral										
Rat	gavage	50	44	2	202	2.2	3.5		100	
Intraven										
ous										
Rat	injection	10						13.6	1.1	100
Oral										
Cyno	gavage	5	8	0.75	28.5	7.1	7.9		52	
Intraven										
ous										
Cyno	injection	1						3.9	1.6	52

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (83.03 mM; 超声助溶 (<60°C); 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		2.4911 mL		12.4555 mL		24.9109 mL				
			5 mM		0.4982 mL		2.4911 mL		4.9822 mL		
			10 mM		0.2491 mL		1.2455 mL		2.4911 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 (5.18 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 (5.18 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]. Borzilleri RM, et al. Discovery and evaluation of N-cyclopropyl-2,4-difluoro-5-((2-(pyridin-2-ylamino)thiazol-5-ylmethyl)amino)benzamide (BMS-605541), a selective and orally efficacious inhibitor of vascular endothelial growth factor receptor-2. J Med Chem. 2006 Jun 29;49(13):3766-9.				
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。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4911 mL	12.4555 mL	24.9109 mL	62.2774 mL
	5 mM	0.4982 mL	2.4911 mL	4.9822 mL	12.4555 mL
	10 mM	0.2491 mL	1.2455 mL	2.4911 mL	6.2277 mL
	15 mM	0.1661 mL	0.8304 mL	1.6607 mL	4.1518 mL
	20 mM	0.1246 mL	0.6228 mL	1.2455 mL	3.1139 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

	25 mM	0.0996 mL	0.4982 mL	0.9964 mL	2.4911 mL
	30 mM	0.0830 mL	0.4152 mL	0.8304 mL	2.0759 mL
	40 mM	0.0623 mL	0.3114 mL	0.6228 mL	1.5569 mL
	50 mM	0.0498 mL	0.2491 mL	0.4982 mL	1.2455 mL
	60 mM	0.0415 mL	0.2076 mL	0.4152 mL	1.0380 mL
	80 mM	0.0311 mL	0.1557 mL	0.3114 mL	0.7785 mL



源叶