

产品名称: (E)-3-(2-(1H-TETRAZOL-5-YL)VINYL)-6-FLUORO-1H-INDOLE

产品别名: LM10

生物活性:					
Description	LM10 是选择性色氨酸双加氧酶(TDO)抑制剂, 抑制人源和鼠源 TDO 的 IC50 分别为 0.62 μM 和 2 μM。				
IC50 & Target	mTDO [1] (in P815B cells)				
	2 μM				
In Vitro	LM10 (Ki=5.6 μM)具有很高的选择性, 对 IDO 没有抑制作用[1]。				
In Vivo	LM10 在小鼠中给药后, 具有较高的血浆浓度和口服生物利用度。小鼠口服 160 mg/kg/day LM10 后, 其药物血浆浓度在 20-40 μg/mL (87-175 μM) 之间。用 160 (mg/kg)/day LM10 对免疫小鼠进行全身处理, 能够抑制表达 TDO 的 P815 肿瘤细胞的生长。LM10 处理的小鼠没有明显的毒性症状[1][2]				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO :45 mg/mL (196.33 mM) Ethanol: 30 mg/mL (130.88 mM) Water: Insoluble				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent Mass Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	4.3628 mL	21.8141 mL	43.6281 mL
		5 mM	0.8726 mL	4.3628 mL	8.7256 mL
		10 mM	0.4363 mL	2.1814 mL	4.3628 mL
		50 mM	0.0873 mL	0.4363 mL	0.8726 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。				
References	[1] Dolusić E, et al. J Med Chem. 2011, 54(15):5320-34. [2] Pilotte L, et al. Proc Natl Acad Sci U S A. 2012, 109(7):2497-502.				
实验参考:					
Cell Assay	细胞实验: [1] Cell lines: P815B 细胞 Concentrations: 2, 20 或 200 μM Incubation Time: 8 h Method: 将细胞以 2×10 ⁵ 细胞/孔的密度接种于 96 孔板, 培养基终体积为 200 μL。为了检测小分子化合物的 TDO 抑制效力, 将细胞置于 HBSS 中, 37°C 培养箱培养 8 小时, HBSS 中添加有 80 μM L-tryptophan 和 2, 20 或 200 μM 的小分子化合物。为了测定 IC50, 细胞置于添加有 80 μM L-tryptophan 和 0.3-80 μM 或 1.5-400 μM 小分子的 HBSS 中, 37°C 培养 8 小时。然后, 300g 离心 10 min, 收集 150 μL 的离心后上清液。其他的留下检测细胞活性。用 HPLC 检测上清液, 检测残余色氨酸和生成的犬尿素。				
	动物实验: [1] Animal Models: DBA/2 小鼠				

Animal Administration	Formulation: 水 Dosages: 160 mg/kg Administration: 口服
References	<p>[1] Dolusić E, et al. J Med Chem. 2011, 54(15):5320-34.</p> <p>[2] Pilotte L, et al. Proc Natl Acad Sci U S A. 2012, 109(7):2497-502.</p>



源叶生物