

产品别名: **DDR1-IN-1**

Description	DDR1-IN-1 is a potent and selective DDR1 receptor tyrosine kinase inhibitor with an IC50 of 105 nM; 4-fold less potent for DDR2 (IC50 = 413 nM)[1].				
IC50 & Target	IC50: 105 nM (DDR1)[1]				
In Vitro	DDR1-IN-1 effectively blocks collagen-induced DDR1 pY513 autophosphorylation in U2OS cells (EC50 = 86.76 nM) with excellent selectivity over a panel of >380 kinases. DDR1-IN-1 inhibits DDR2-mediated MT1-MMP activation in human rheumatoid synovial fibroblasts (RASf) upon collagen stimulation (IC50 < 2.5 μM) and enhances PI3K/mTOR inhibitor GSK2126458 antiproliferation efficacy in SNU-1040 colorectal cancer culture[1].				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 100 mg/mL (180.97 mM; Need ultrasonic) H2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8097 mL	9.0483 mL	18.0966 mL
		5 mM	0.3619 mL	1.8097 mL	3.6193 mL
		10 mM	0.1810 mL	0.9048 mL	1.8097 mL
	<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限：-80℃，6 months；-20℃，1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。</p> <p>In Vivo:</p> <p>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：</p> <p>——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</p> <div><p>1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline</p><p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.52 mM); Clear solution</p><p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.52 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。</p><p>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；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。</p></div> <div><p>2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)</p><p>Solubility: 2.5 mg/mL (4.52 mM); Suspended solution; Need ultrasonic</p><p>此方案可获得 2.5 mg/mL (4.52 mM)的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p><p>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。</p></div> <div><p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil</p><p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.52 mM); Clear solution</p></div>				

	<p>此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (4.52 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>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。</p>
References	<p>[1]. Kim HG, et al. Discovery of a potent and selective DDR1 receptor tyrosine kinase inhibitor. <u>ACS Chem Biol.</u> 2013 Oct 18;8(10):2145-50.</p>



源叶生物