



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

产品名称: **KDM5-IN-1**
产品别名: **KDM5-IN-1**

生物活性:				
Description	KDM5-IN-1 is a potent, selective and orally bioavailable KDM5 inhibitor with an IC ₅₀ of 15.1 nM.			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 15.1 nM (KDM5); EC ₅₀ : 0.34 μM (PC9 H3K4Me3) ^[1]			
In Vitro	KDM5-IN-1 is found to potently inhibit KDM5B and KDM5C isoforms (IC ₅₀ of 4.7 and 65.5 nM, respectively). It is significantly less potent against other KDM enzymes (1A, 2B, 3B, 4C, 5A, 6A, 7B), inhibiting KDM4C the strongest with an IC ₅₀ of 1.9 μM. KDM5-IN-1 still displays more than 100-fold selectivity for KDM4C vs. KDM5A ^[1] .			
In Vivo	When dosed orally in mice at 50 mg/kg twice a day, KDM5-IN-1 shows an unbound maximal plasma concentration C _{max} >15-fold over its cell EC ₅₀ , thereby providing a robust chemical probe for studying KDM5 biological functions <i>in vivo</i> ^[1] .			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 30 mg/mL (92.48 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	3.0828 mL	15.4140 mL
		5 mM	0.6166 mL	3.0828 mL
		10 mM	0.3083 mL	1.5414 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。			
	In Vivo: 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 1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.41 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (6.41 mM, 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, 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。 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.41 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (6.41 mM, 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			



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

	盐水水溶液中，混合均匀。
References	[1]. Liang J, et al. Lead optimization of a pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7(4H)-one scaffold to identify potent, selective and orally bioavailable KDM5 inhibitors suitable for in vivo biological studies. Bioorg Med Chem Lett. 2016 Aug 15;26(16):4036-41.



源叶生物