



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: **KDM5A-IN-1**
产品别名: **KDM5A-IN-1**

生物活性:

Description	KDM5A-IN-1 is a potent, orally bioavailable pan-histone lysine demethylases 5 (KDM5) inhibitor with IC50s of 45 nM, 56 nM and 55 nM for KDM5A, KDM5B and KDM5C, respectively, and with an EC50 value of 960 nM for PC9 H3K4Me3. KDM5A-IN-1 is significantly less potent against other KDM5B enzymes (1A, 2B, 3B, 4C, 6A, 7B)[1].				
IC50 & Target	IC50: 45 nM (KDM5A), 56 nM (KDM5B) and 55 nM (KDM5C)[1]				
In Vivo	KDM5A-IN-1 (Compound 50, 5 mg/kg; oral administration; female CD-1 mice) treatment shows moderate clearance (28 mL/min/kg) in mice with good oral bioavailability (F% 34) and remarkably low plasma protein binding in mice (40%), with t1/2 of 0.4 hours ^[1] .				
	Animal Model:	Female CD-1 mice[1]			
	Dosage:	5 mg/kg			
	Administration:	Oral administration (Pharmacokinetic study)			
	Result:	Moderate clearance (28 mL/min/kg) in mice with good oral bioavailability (F% 34), and showed remarkably low plasma protein binding in mice (40%).			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 50 mg/mL (172.20 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.4440 mL	17.2200 mL	34.4400 mL
		5 mM	0.6888 mL	3.4440 mL	6.8880 mL
		10 mM	0.3444 mL	1.7220 mL	3.4440 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: ≥ 2.75 mg/mL (9.47 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (9.47 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 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。				



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

	<p>2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (9.47 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (9.47 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。</p> <p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (9.47 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (9.47 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 27.5 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]. Liang J, et al. From a novel HTS hit to potent, selective, and orally bioavailable KDM5 inhibitors. Bioorg Med Chem Lett. 2017 Jul 1;27(13):2974-2981.</p>

源叶生物