

Catalog Number: CM04704

产品信息

Catalog Number:
CM04704

CAS号:
198474-05-4

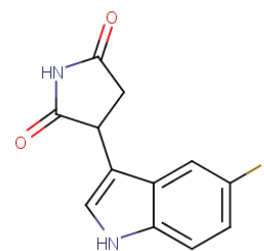
分子式:
 $C_{12}H_9FN_2O_2$

主要靶点:
IDO|Indoleamine 2,3-Dioxygenase (IDO)

主要通路:
代谢|代谢

分子量:
232.21

溶解度:
DMSO:60 mg/mL (258.39 mM)



靶点活性

IDO1 (human):0.41 μ M|IDO1 (mouse):1.5 μ M|dIDO1:0.59 μ M

体外活性

PF-06840003对hIDO-1 (IC₅₀: 0.41 μ M)、mouse IDO-1 (IC₅₀: 1.5 μ M)及dog IDO-1 (IC₅₀: 0.59 μ M)均显示出抑制活性,但对hTDO-2的抑制作用非常弱 (IC₅₀: 140 μ M)。在细胞测试中,PF-06840003在LPS/INF γ 刺激的THP1细胞 (IC₅₀: 1.7 μ M)和HeLa测试中 (IC₅₀: 1.8 μ M)均展现出活性。除了对2C19 (IC₅₀: 78 μ M)有一定的抑制效果外,PF-06840003对CYPs的抑制作用非常弱 (IC₅₀>100 μ M)。

体内活性

在小鼠中,PF-06840003能显著降低肿瘤内kynurenine水平 (>80%)。在多项小鼠同源移植模型的前临床研究中,PF-06840003联合免疫检查点抑制剂可有效抑制肿瘤生长。此外,PF-06840003还展现出了良好的人类药代动力学预测属性,包括预测的半衰期为16-19小时。

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.