



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: **ASTX029**
CAS 号: **2095719-92-7**
产品货号: **S20663**

生物活性:

Description	ASTX029 (Example 1) 是有效的 ERK1/2 双重抑制剂 (IC50: 2.7 nM)。ASTX029 具有抗癌活性。				
In Vitro	STX029 (96 h) 抑制具有 MAPK 激活突变的人类癌细胞的增殖, IC50 值为 1.8 至 380 nM[2]。 ASTX029 (2 h) 抑制 A375 和 HCT116 细胞中 RSK 的磷酸化, IC50 值分别为 3.3 和 4 nM, 并降低 pERK 水平[2]。 ASTX029 (10 和 100 nM, 0-72 小时) 诱导细胞周期停滞在 G1 期, 并诱导 A375 和 HCT116 细胞凋亡[2]。				
In Vivo	ASTX029 (20-75 mg/kg, 口服) 可抑制 Colo205 (BRAFV600E-突变型结直肠癌) 荷瘤小鼠的肿瘤生长[2]。 ASTX029 (5 mg/kg, 口服, 小鼠) 显示 AUC 为 1600 ng h/mL, T1/2 为 2.9 小时, F (%) 为 42%[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (428.05 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.7122 mL	8.5611 mL	17.1221 mL
		5 mM	0.3424 mL	1.7122 mL	3.4244 mL
		10 mM	0.1712 mL	0.8561 mL	1.7122 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。				
	动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.56 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (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; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。				



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

	方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (3.56 mM); 悬浊液; 超声助溶。 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.56 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 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 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Michael Reader, et al. 6-pyrimidin-isoindole derivative as erk1/2 inhibitor. WO2018193410A1. [2]. Munck JM, et al. ASTX029, a Novel Dual-mechanism ERK Inhibitor, Modulates Both the Phosphorylation and Catalytic Activity of ERK. Mol Cancer Ther. 2021 Oct;20(10):1757-1768 .

完整储备液配制表:

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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.7122 mL	8.5611 mL	17.1221 mL	42.8053 mL
	5 mM	0.3424 mL	1.7122 mL	3.4244 mL	8.5611 mL
	10 mM	0.1712 mL	0.8561 mL	1.7122 mL	4.2805 mL
	15 mM	0.1141 mL	0.5707 mL	1.1415 mL	2.8537 mL
	20 mM	0.0856 mL	0.4281 mL	0.8561 mL	2.1403 mL
	25 mM	0.0685 mL	0.3424 mL	0.6849 mL	1.7122 mL
	30 mM	0.0571 mL	0.2854 mL	0.5707 mL	1.4268 mL
	40 mM	0.0428 mL	0.2140 mL	0.4281 mL	1.0701 mL
	50 mM	0.0342 mL	0.1712 mL	0.3424 mL	0.8561 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

	60 mM	0.0285 mL	0.1427 mL	0.2854 mL	0.7134 mL
	80 mM	0.0214 mL	0.1070 mL	0.2140 mL	0.5351 mL
	100 mM	0.0171 mL	0.0856 mL	0.1712 mL	0.4281 mL



源叶