



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: shyyssw@sina.com

产品名称: RET V804M-IN-1

CAS 号: 2414909-94-5

产品货号: S87673

生物活性:

Description	RET V804M-IN-1 (compound 5) 是 wt-RET 选择性的 RETV804M 激酶抑制剂, 其 IC50 值为 20 nM。			
IC50 & Target	IC50: 20 nM (RETV804M)[1].			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BaF3	IC ₅₀	3.9 μ M	Inhibition of RET V804M mutant (unknown origin)expressed in human BaF3 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs by celltiter glo luminescence cell viability assay
In Vitro	与 wt-RET 和 KDR 相比, RET V804M-IN-1 (化合物 5) 的选择性分别高出 3.7 和 110 倍[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (362.98 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	2.9039 mL	14.5193 mL
		5 mM	0.5808 mL	2.9039 mL
		10 mM	0.2904 mL	1.4519 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (6.04 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- β -CD in Saline)				



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: shyyssw@sina.com

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.04 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 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.04 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。
参考文献	[1]. Rebecca Newton, et al. Discovery and Optimization of wt-RET/KDR-Selective Inhibitors of RET V804M Kinase. ACS Med Chem Lett. 2020 Feb 28;11(4):497-505.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	2.9039 mL	14.5193 mL	29.0385 mL	72.5963 mL
	5 mM	0.5808 mL	2.9039 mL	5.8077 mL	14.5193 mL
	10 mM	0.2904 mL	1.4519 mL	2.9039 mL	7.2596 mL
	15 mM	0.1936 mL	0.9680 mL	1.9359 mL	4.8398 mL
	20 mM	0.1452 mL	0.7260 mL	1.4519 mL	3.6298 mL
	25 mM	0.1162 mL	0.5808 mL	1.1615 mL	2.9039 mL
	30 mM	0.0968 mL	0.4840 mL	0.9680 mL	2.4199 mL
	40 mM	0.0726 mL	0.3630 mL	0.7260 mL	1.8149 mL
	50 mM	0.0581 mL	0.2904 mL	0.5808 mL	1.4519 mL
	60 mM	0.0484 mL	0.2420 mL	0.4840 mL	1.2099 mL
	80 mM	0.0363 mL	0.1815 mL	0.3630 mL	0.9075 mL
	100 mM	0.0290 mL	0.1452 mL	0.2904 mL	0.7260 mL