



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: F-1

CAS 号: 2244775-31-1

产品货号: S87933

生物活性:

Description	F-1 是一种有效的 ALK 和 ROS1 的双重抑制剂, 抑制 ALK 的磷酸化及下游通路, 对 ALKWT, ROS1WT, ALKL1196M 和 ALKG1202R 的 IC50 值分别为 2.1 nM, 2.3 nM, 1.3 nM 和 3.9 nM。				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	A549	IC50	> 1 μM	Antiproliferative activity against human A549 cells after 72 hrs by MTT assay	
	BaF3	IC50	0.03 μM	Antiproliferative activity against mouse BAF3 cells harboring G1202R mutation after 72 hrs by MTT assay	
	HCC78	IC50	0.043 μM	Antiproliferative activity against human HCC78 cells harboring SLC34A2-ROS1 after 72 hrs by MTT assay	
	KARPAS-299	IC50	0.01 μM	Antiproliferative activity against human KARPAS299 cells harboring NPM-ALK after 72 hrs by MTT assay	
	NCI-H2228	IC50	0.012 μM	Antiproliferative activity against human NCI-H2228 cells harboring EML4-ALK after 72 hrs by MTT assay	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (240.84 mM); 超声助溶 (<65°C); 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	1.9267 mL	9.6335 mL	19.2671 mL
		5 mM	0.3853 mL	1.9267 mL	3.8534 mL
		10 mM	0.1927 mL	0.9634 mL	1.9267 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 (protect from light)。-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 (4.01 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 ddH₂O 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) Solubility: 2.08 mg/mL (4.01 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 (4.01 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]. Guo M, et al. Dual potent ALK and ROS1 inhibitors combating drug-resistant mutants: Synthesis and biological evaluation of aminopyridine-containing diarylaminopyrimidine derivatives. Eur J Med Chem. 2018 Sep 6;158:322-333.

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 (protect from light)。-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	1.9267 mL	9.6335 mL	19.2671 mL	48.1677 mL
	5 mM	0.3853 mL	1.9267 mL	3.8534 mL	9.6335 mL
	10 mM	0.1927 mL	0.9634 mL	1.9267 mL	4.8168 mL
	15 mM	0.1284 mL	0.6422 mL	1.2845 mL	3.2112 mL
	20 mM	0.0963 mL	0.4817 mL	0.9634 mL	2.4084 mL
	25 mM	0.0771 mL	0.3853 mL	0.7707 mL	1.9267 mL
	30 mM	0.0642 mL	0.3211 mL	0.6422 mL	1.6056 mL
	40 mM	0.0482 mL	0.2408 mL	0.4817 mL	1.2042 mL
	50 mM	0.0385 mL	0.1927 mL	0.3853 mL	0.9634 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	0.0321 mL	0.1606 mL	0.3211 mL	0.8028 mL
	80 mM	0.0241 mL	0.1204 mL	0.2408 mL	0.6021 mL
	100 mM	0.0193 mL	0.0963 mL	0.1927 mL	0.4817 mL



源叶