



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: **KO-947**
CAS 号: **1695533-89-1**
产品货号: **S88466**

生物活性:

Description	KO-947 是有效和选择性的 ERK1/2 激酶抑制剂, 在 MAPK 途径失调的肿瘤中具有潜在效用。				
IC50 & Target[1]	ERK1		ERK2		
In Vitro	KO-947 是一种 10 nM 的 ERK 抑制剂, 对一组 450 种激酶具有至少 50 倍的选择性。KO-947 在低纳摩尔浓度下阻断 ERK 信号和表现出 MAPK 通路信号失调的肿瘤细胞增殖, 包括 BRAF、NRAS 或 KRAS 中的突变[1]。				
In Vivo	在细胞系衍生的异种移植研究中, KO-947 在单次给药后长达五天的时间内深度抑制 ERK 信号, 并在 RAS 和 RAF 突变黑色素瘤、NSCLC 和胰腺癌模型中诱导回归, 给药时间表从每天到每周不等。间歇给药可在降低剂量强度的情况下实现类似的抗肿瘤活性[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 62.5 mg/mL (175.86 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	2.8138 mL	14.0691 mL	28.1381 mL
		5 mM	0.5628 mL	2.8138 mL	5.6276 mL
		10 mM	0.2814 mL	1.4069 mL	2.8138 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 (5.85 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。 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 (5.85 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。				



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

	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: $\geq$ 2.08 mg/mL (5.85 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, 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]. Burrows F, et al. KO-947, a potent ERK inhibitor with robust preclinical single agent activity in MAPK pathway dysregulated tumors [abstract]. In: Proceedings of the American Association for Cancer Research Annual Meeting 2017; 2017 Apr 1-5; Washington, DC. Philadelphia (PA): AACR; Cancer Res 2017;77(13 Suppl):Abstract nr 5168. doi:10.1158/1538-7445.AM2017-5168.

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 (protect from light)。-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	2.8138 mL	14.0691 mL	28.1381 mL	70.3453 mL
	5 mM	0.5628 mL	2.8138 mL	5.6276 mL	14.0691 mL
	10 mM	0.2814 mL	1.4069 mL	2.8138 mL	7.0345 mL
	15 mM	0.1876 mL	0.9379 mL	1.8759 mL	4.6897 mL
	20 mM	0.1407 mL	0.7035 mL	1.4069 mL	3.5173 mL
	25 mM	0.1126 mL	0.5628 mL	1.1255 mL	2.8138 mL
	30 mM	0.0938 mL	0.4690 mL	0.9379 mL	2.3448 mL
	40 mM	0.0703 mL	0.3517 mL	0.7035 mL	1.7586 mL
	50 mM	0.0563 mL	0.2814 mL	0.5628 mL	1.4069 mL
	60 mM	0.0469 mL	0.2345 mL	0.4690 mL	1.1724 mL
	80 mM	0.0352 mL	0.1759 mL	0.3517 mL	0.8793 mL
	100 mM	0.0281 mL	0.1407 mL	0.2814 mL	0.7035 mL