



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **CPD1588**
CAS 号: **1698055-85-4**
产品货号: **S88468**

生物活性:				
Description	ARS-1620 是一种阻转异构且有选择性的 KRASG12C 抑制剂, 具有理想的药代动力学。			
IC50 & Target[1]	KRAS(G12C)			
In Vitro	ARS-1620 是一种阻转异构体选择性 KRASG12C 抑制剂, 具有理想的药代动力学。ARS-1620 对 p.G12C 细胞系的生长有完全抑制作用 (IC50=150 nM), 对对照细胞系的影响相对较小。研究发现, ARS-1620 以时间依赖性方式显著降低 p.G12C 突变细胞中基因集的表达, 但对 p.G12S 突变细胞则无影响。经过 5 天的治疗期, 在单层培养条件下, 只有少数 G12C 突变细胞系对 ARS-1620 敏感, 而在 3D 球体条件下, ARS-1620 会引起强烈反应 (p=0.0140)[1]。			
In Vivo	单次口服或连续 5 天每日给药后, ARS-1620 的平均肿瘤峰浓度分别为 1.5 μM (50 mg/kg) 和 5.5 μM (200 mg/kg), 可显著提高 KRASG12C 靶向占据率 (>=70% G12C-TE, 200 mg/kg 剂量), 且持续时间 >24 小时。在 MIAPaCa2 异种移植瘤中, ARS-1620 以剂量依赖性方式显著抑制肿瘤生长, 每日一次给药 200 mg/kg 剂量时肿瘤明显消退。在所有采用的肿瘤模型中, ARS-1620 在整个 3 周的治疗期内均具有良好的耐受性。此外, 即使在 7 天内每日口服高达 1,000 mg/kg 的 ARS-1620 剂量, CD-1 小鼠中也未观察到任何临床症状或毒性。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (290.13 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) H2O 中的溶解度 : 11 mg/mL (25.53 mM; 超声助溶; 酸性条件溶解 (HCl 调节, pH=3))			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
				10 mg
		1 mM	2.3210 mL	11.6052 mL
		5 mM	0.4642 mL	2.3210 mL
		10 mM	0.2321 mL	1.1605 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。 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 (4.83 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 (4.83 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.83 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]. Janes MR, et al. Targeting KRAS Mutant Cancers with a Covalent G12C-Specific Inhibitor. Cell. 2018 Jan 25;172(3):578-589.e17.

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, 2 years; -20° C, 1 year. -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.3210 mL	11.6052 mL	23.2105 mL	58.0262 mL
	5 mM	0.4642 mL	2.3210 mL	4.6421 mL	11.6052 mL
	10 mM	0.2321 mL	1.1605 mL	2.3210 mL	5.8026 mL
	15 mM	0.1547 mL	0.7737 mL	1.5474 mL	3.8684 mL
	20 mM	0.1161 mL	0.5803 mL	1.1605 mL	2.9013 mL
	25 mM	0.0928 mL	0.4642 mL	0.9284 mL	2.3210 mL
DMSO	30 mM	0.0774 mL	0.3868 mL	0.7737 mL	1.9342 mL
	40 mM	0.0580 mL	0.2901 mL	0.5803 mL	1.4507 mL
	50 mM	0.0464 mL	0.2321 mL	0.4642 mL	1.1605 mL
	60 mM	0.0387 mL	0.1934 mL	0.3868 mL	0.9671 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

	80 mM	0.0290 mL	0.1451 mL	0.2901 mL	0.7253 mL
	100 mM	0.0232 mL	0.1161 mL	0.2321 mL	0.5803 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶