



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: **XL999**
CAS 号: **705946-27-6**
产品货号: **S88703**

生物活性:

Description	XL 999 是多靶点的酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 KDR, Flt-1, FGFR1 和 PDGFR α 的 IC50 值分别为 4, 20, 4, 2 nM。XL 999 可用于肿瘤的研究。				
IC50 & Target	Flt-1 4 nM (IC50)	KDR 20 nM (IC50)	PDGFRα 4 nM (IC50)	FGFR1 2 nM (IC50)	
In Vitro	Tyrosine kinase-IN-1 来自参考文献 (化合物 8K)[1]				
In Vivo	Tyrosine kinase-IN-1 显示出合理的 PK 曲线 (AUC (0 - ∞)=1.9, t1/2=4.6 h)。它在大鼠体内有良好的口服生物利用度 (F=63%)[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (112.23 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	2.2445 mL	11.2226 mL	22.4452 mL
		5 mM	0.4489 mL	2.2445 mL	4.4890 mL
		10 mM	0.2245 mL	1.1223 mL	2.2445 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。 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 (4.67 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 (4.67 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。
参考文献	[1]. Moon K, et al. The design, synthesis, and biological evaluation of potent receptor tyrosine kinase inhibitors. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 22 (2012) 4979–4985

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
DMSO	1 mM	2.2445 mL	11.2226 mL	22.4452 mL	56.1129 mL
	5 mM	0.4489 mL	2.2445 mL	4.4890 mL	11.2226 mL
	10 mM	0.2245 mL	1.1223 mL	2.2445 mL	5.6113 mL
	15 mM	0.1496 mL	0.7482 mL	1.4963 mL	3.7409 mL
	20 mM	0.1122 mL	0.5611 mL	1.1223 mL	2.8056 mL
	25 mM	0.0898 mL	0.4489 mL	0.8978 mL	2.2445 mL
	30 mM	0.0748 mL	0.3741 mL	0.7482 mL	1.8704 mL
	40 mM	0.0561 mL	0.2806 mL	0.5611 mL	1.4028 mL
	50 mM	0.0449 mL	0.2245 mL	0.4489 mL	1.1223 mL
	60 mM	0.0374 mL	0.1870 mL	0.3741 mL	0.9352 mL
	80 mM	0.0281 mL	0.1403 mL	0.2806 mL	0.7014 mL
	100 mM	0.0224 mL	0.1122 mL	0.2245 mL	0.5611 mL