



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: shyyw@sina.com

产品名称: RU-301
CAS 号: 1110873-99-8
产品货号: S89032

生物活性:	
Description	RU-301 是一种泛型 TAM 抑制剂, 能阻断 Gas6 诱导的 TAM 激活和致瘤性。RU-301 能显著减少小鼠非酒精性脂肪性肝炎 (NASH) 的纤维化, 同时减弱 ERK 的激活和 TGFβ1 的表达。RU-301 可用于癌症和非酒精性脂肪性肝炎的研究。
In Vitro	RU-301 (10 μM; 30 分钟) 抑制 H1299 细胞中的天然 TAM 激活[1]。
	RU-301 (10 μM; 24 小时) 抑制 H1299 和 MDA-MB-231 细胞的迁移[1]。
	RU-301 (10 μM; 14 天) 在 Gas6 下抑制 H1299 克隆细胞的生长[1]。
	Cell Viability Assay[1]
	Cell Line: H1299, MDA-MB-231 cells
	Concentration: 10 μM (for H1299); 2.5, 5 μM (for MDA-MB-231)
	Incubation Time: 30 min (pre-incubate)
	Result: Suppressed Gas6-inducible native phosphorylation of native Axl. Partially blocked Gas6-induced activation of Akt and Erk in H1299 or MDA-MB-231 at 5 μM. Inhibited the Gas6-induced phosphorylation of not only native Axl but also native Tyro3 and MerTK in H1299 at 10 μM.
	Cell Migration Assay[1]
	Cell Line: H1299, MDA-MB-231 cells
	Concentration: 10 μM
	Incubation Time: 24 h
	Result: Strongly suppressed Gas6-inducible motility of H1299 lung cancer cell line.
	Cell Viability Assay[1]
	Cell Line: H1299 cells
	Concentration: 10 μM
	Incubation Time: 14 days
	Result: Suppressed clonogenic growth of H1299 cells when cultured in the presence of Gas6.
In Vivo	RU-301 (100、300 mg/kg; 腹腔注射; 每天一次, 持续 4 天) 抑制肺癌异种移植模型中的肿瘤生长[1]。
	RU-301 (300 mg/kg; 腹腔注射; 每周 3 次, 持续 4 周) 减少小鼠的肝纤维化[2]
	Animal Model: NOD/SCIDγ mice (4-6 week; lung cancer xenograft model)[1].
	Dosage: 100, 300 mg/kg
	Administration: Intraperitoneal injection; single daily for 4 days
	Result: Significantly decreased tumor volume while body weights were not significantly different. Showed no notable toxicity but displayed good bioavailability with a t _{1/2} life of ~7-8 hours.
	Animal Model: WT or Mertk ^{-/-} male mice (fed NASH diet for 12 weeks)[2].
	Dosage: 300 mg/kg



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

	Administration:	Intraperitoneal injection; 3 times a week for 4 weeks			
	Result:	Reduced liver fibrosis as indicated by decreases in liver picrosirius red staining and collagen gene expression.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (208.13 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0813 mL	10.4067 mL	20.8134 mL
		5 mM	0.4163 mL	2.0813 mL	4.1627 mL
		10 mM	0.2081 mL	1.0407 mL	2.0813 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 (4.33 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。					
参考文献	[1]. Kimani SG, et al. Small molecule inhibitors block Gas6-inducible TAM activation and tumorigenicity. Sci Rep. 2017 Mar 8;7:43908. [2]. Cai B, et al. Macrophage MerTK Promotes Liver Fibrosis in Nonalcoholic Steatohepatitis. Cell Metab. 2020 Feb 4;31(2):406-421.e7.				
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
	1 mM	2.0813 mL	10.4067 mL	20.8134 mL	52.0335 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: shyyssw@sina.com

DMSO	5 mM	0.4163 mL	2.0813 mL	4.1627 mL	10.4067 mL
	10 mM	0.2081 mL	1.0407 mL	2.0813 mL	5.2033 mL
	15 mM	0.1388 mL	0.6938 mL	1.3876 mL	3.4689 mL
	20 mM	0.1041 mL	0.5203 mL	1.0407 mL	2.6017 mL
	25 mM	0.0833 mL	0.4163 mL	0.8325 mL	2.0813 mL
	30 mM	0.0694 mL	0.3469 mL	0.6938 mL	1.7344 mL
	40 mM	0.0520 mL	0.2602 mL	0.5203 mL	1.3008 mL
	50 mM	0.0416 mL	0.2081 mL	0.4163 mL	1.0407 mL
	60 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3469 mL	0.8672 mL
	80 mM	0.0260 mL	0.1301 mL	0.2602 mL	0.6504 mL
	100 mM	0.0208 mL	0.1041 mL	0.2081 mL	0.5203 mL

