



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: **KRAS inhibitor-9**

CAS 号: **300809-71-6**

产品货号: **S89103**

生物活性:

生物活性:

Description	KRAS inhibitor-9 是有效的 KRAS 抑制剂 ($K_d=92\ \mu\text{M}$), 阻止 GTP-KRAS 的形成和 KRAS 下游激活。KRAS inhibitor-9 以中等的结合亲和力与 KRAS G12D, KRAS G12C 和 KRAS Q61H 蛋白结合。KRAS inhibitor-9 导致 G2/M 细胞周期停滞并诱导凋亡 (apoptosis)。KRAS inhibitor-9 选择性抑制具有 KRAS 突变的 NSCLC 细胞的增殖, 但不抑制正常肺细胞的增殖。				
In Vitro	KRAS inhibitor-9 bound to KRASG12D, KRAS G12C and KRAS Q61H protein with a moderate binding affinity of -5.38, -5.41, and -3.97 kcal/mol, respectively[1].				
	KRAS inhibitor-9 (0-100 μM) shows strong inhibition selectivity in NSCLC cells with IC50s ranging from 39.56 to 66.02 μM for H2122, H358 and H460 cells (at 72 hours)[1].				
	KRAS inhibitor-9 (0-100 μM ; 24 hours) blocks GTP-KRAS formation in H2122, H358 and H460 cells[1].				
	KRAS inhibitor-9 (25-100 μM ; 48 hours) inhibits the activation of KRAS downstream signaling pathway[1].				
	KRAS inhibitor-9 (0-100 μM ; 24-72 hours) induces cell cycle arrest and apoptosis in NSCLC[1]。Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:	H2122 (KRAS G12C), H358 (KRAS G12C) and H460 (KRAS Q61H) cell lines			
	Concentration:	0, 25, 50, 100 μM			
	Incubation Time:	24, 48, and 72 hours			
	Result:	Inhibited three NSCLC cell lines in a dose- and time-dependent manner, but not in normal lung fibroblast cell line CCD-19Lu.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	H2122, H358 and H460 cells			
	Concentration:	0, 25, 50, 100 μM			
	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	Reduces the levels of phosphorylation of CRAF and AKT in a dose-dependent manner in H2122, H358 and H460 cells.			
	Apoptosis Analysis[1]				
	Cell Line:	H2122, H358, H460 cells			
	Concentration:	0, 25, 50, 100 μM			
	Incubation Time:	24-72 hours			
	Result:	Significantly decreased in G0/G1 phase while remarkably increased in G2/M phase after 24 hours and induced a significantly increased apoptosis for 48h in NSCLC cell lines.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (853.80 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	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM		3.4152 mL	17.0759 mL	34.1518 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

	Stock Solutions	5 mM	0.6830 mL	3.4152 mL	6.8304 mL
		10 mM	0.3415 mL	1.7076 mL	3.4152 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.10 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 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.10 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]. Xie C, et al. Identification of a New Potent Inhibitor Targeting KRAS in Non-small Cell Lung Cancer Cells. Front Pharmacol. 2017;8:823. Published 2017 Nov 14.				

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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积				
	浓度				
DMSO	1 mM	3.4152 mL	17.0759 mL	34.1518 mL	85.3796 mL
	5 mM	0.6830 mL	3.4152 mL	6.8304 mL	17.0759 mL
	10 mM	0.3415 mL	1.7076 mL	3.4152 mL	8.5380 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

	15 mM	0.2277 mL	1.1384 mL	2.2768 mL	5.6920 mL
	20 mM	0.1708 mL	0.8538 mL	1.7076 mL	4.2690 mL
	25 mM	0.1366 mL	0.6830 mL	1.3661 mL	3.4152 mL
	30 mM	0.1138 mL	0.5692 mL	1.1384 mL	2.8460 mL
	40 mM	0.0854 mL	0.4269 mL	0.8538 mL	2.1345 mL
	50 mM	0.0683 mL	0.3415 mL	0.6830 mL	1.7076 mL
	60 mM	0.0569 mL	0.2846 mL	0.5692 mL	1.4230 mL
	80 mM	0.0427 mL	0.2134 mL	0.4269 mL	1.0672 mL
	100 mM	0.0342 mL	0.1708 mL	0.3415 mL	0.8538 mL



源叶