



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: **APS6-45**
CAS 号: **2188236-41-9**
产品货号: **S89149**

生物活性:

Description	APS6-45 是一种口服活性的肿瘤校准抑制剂 (TCI)。APS6-45 抑制 RAS/MAPK 信号传导并表现出抗肿瘤活性。				
In Vitro	APS6-45 (3-30 nM; 3 weeks) strongly suppresses TT human Medullary Thyroid Carcinoma (MTC) cells colony formation in a soft agar assay[1]. APS6-45 (1 μ M; 1 h) strongly inhibits RAS pathway activity signaling in human MTC cell lines TT and MZ-CRC-1[1]。				
In Vivo	APS6-45 (10 mg/kg; p.o. daily for 30 d) inhibits growth of TT tumors in mice and does not affect body weight[1]. APS6-45 (0.1-160 mg/kg; a single p.o.) does not cause detectable toxic effects in mice[1]. APS6-45 (20 mg/kg; a single p.o.) exhibits long half-life (5.6 h), Cmax (9.7 μ M) and AUC0-24 (123.7 μ M h) in mice[1].				
	Animal Model:	Female nude mice (6 weeks) are implanted with TT cells[1]			
	Dosage:	10 mg/kg			
	Administration:	P.o. daily for 30 days			
	Result:	Led to partial or complete responses in 75% and was well tolerated.			
	Animal Model:	Male ICR mice (6 weeks of age)[1]			
	Dosage:	20 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)			
	Administration:	A single p.o.			
	Result:	T1/2=5.6 h, Cmax=9.7 μ M, AUC0-24=123.7 μ M•h.			
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (455.88 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	1.8235 mL	9.1176 mL	18.2352 mL
		5 mM	0.3647 mL	1.8235 mL	3.6470 mL
		10 mM	0.1824 mL	0.9118 mL	1.8235 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					



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

	方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.79 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]. Sonoshita M, et, al. A whole-animal platform to advance a clinical kinase inhibitor into new disease space. Nat Chem Biol. 2018 Mar;14(3):291-298.

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	1.8235 mL	9.1176 mL	18.2352 mL	45.5880 mL
	5 mM	0.3647 mL	1.8235 mL	3.6470 mL	9.1176 mL
	10 mM	0.1824 mL	0.9118 mL	1.8235 mL	4.5588 mL
	15 mM	0.1216 mL	0.6078 mL	1.2157 mL	3.0392 mL
	20 mM	0.0912 mL	0.4559 mL	0.9118 mL	2.2794 mL
	25 mM	0.0729 mL	0.3647 mL	0.7294 mL	1.8235 mL
	30 mM	0.0608 mL	0.3039 mL	0.6078 mL	1.5196 mL
	40 mM	0.0456 mL	0.2279 mL	0.4559 mL	1.1397 mL
	50 mM	0.0365 mL	0.1824 mL	0.3647 mL	0.9118 mL
	60 mM	0.0304 mL	0.1520 mL	0.3039 mL	0.7598 mL
	80 mM	0.0228 mL	0.1140 mL	0.2279 mL	0.5698 mL
	100 mM	0.0182 mL	0.0912 mL	0.1824 mL	0.4559 mL