



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: **SPP-86**
CAS 号: **1357349-91-7**
产品货号: **S89397**

生物活性:				
Description	SPP-86 是一种选择性的 RET 酪氨酸激酶的有效抑制剂, 其 IC ₅₀ 值为 8 nM。SPP-86 抑制 MCF7 细胞中 RET 诱导激活的 PI3K/Akt 和 MAPK 信号通路, 也能抑制 RET 诱导的 ER α 磷酸化。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 8 nM (RET)[1].			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BaF3	GI ₅₀	0.35 μ M	Inhibition of TEL-fused Ret S891A mutant (unknown origin) expressed in mouse BaF3 cells assessed as cell growth inhibition after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	GI ₅₀	0.61 μ M	Inhibition of wild type TEL-fused RET (unknown origin) expressed in mouse BA/F3 cells assessed as cell growth inhibition after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	GI ₅₀	16.1 μ M	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	GI ₅₀	2.6 μ M	Inhibition of TEL-fused Ret V804M mutant (unknown origin) expressed in mouse BA/F3 cells assessed as cell growth inhibition after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	GI ₅₀	5.43 μ M	Inhibition of TEL-fused Ret V804L mutant (unknown origin) expressed in mouse BaF3 cells assessed as cell growth inhibition after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	IC ₅₀	4500 nM	Growth inhibition of mouse BA/F3 cells expressing Bcr-Abl T315I mutant after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	IC ₅₀	5020 nM	Growth inhibition of mouse BA/F3 cells expressing wild-type Bcr-Abl after 48 hrs by MTT assay
	BaF3	IC ₅₀	> 1000 nM	Antiproliferative activity against mouse BAF3 cells harboring CCDC6-RET fusion protein after 72 hrs by CCK8 assay
	HCT-116	EC ₅₀	2.4 μ M	Antiproliferative activity against human HCT116 cells
	TPC1	EC ₅₀	3.3 μ M	Antiproliferative activity against human TPC1 cells
	TT	GI ₅₀	2.54 μ M	Inhibition of RET C634W mutant in human TT cells assessed as cell growth inhibition after 10 days by MTT assay
In Vitro	SPP86 (0-10 μ M) inhibits MAPK signaling and proliferation in RET/PTC1 expressing TPC1 but not 8505C or C643 cells[1].			
	SPP86 (0-10 μ M) inhibits RET- induced phosphatidylinositide 3-kinases (PI3K)/Akt and MAPK signaling and estrogen receptor α (ER α) phosphorylation in MCF7 cells[1].			
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	Thyroid cancer derived cell lines expressing the RET/PTC1 rearrangement (TPC1), BRAF ^{V600E} (8505C) or RAS ^{G13R} (C643) mutations.		
	Concentration:	0-10 μ M.		
	Incubation Time:	90 min.		



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

	Result:	Inhibited RET- induced ERK1/2 phosphorylation in thyroid cancer cell lines.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	MCF7 cells (human breast cancer).			
	Concentration:	0-10 μ M.			
	Incubation Time:	30 min.			
	Result:	Inhibited RET- induced ER 伪 phosphorylation and proliferation in MCF7 cells.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (360.59 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	3.6059 mL	18.0297 mL	36.0594 mL
		5 mM	0.7212 mL	3.6059 mL	7.2119 mL
		10 mM	0.3606 mL	1.8030 mL	3.6059 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, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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: ≥ 2.5 mg/mL (9.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (9.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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。				



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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Alao JP, et al. Selective inhibition of RET mediated cell proliferation in vitro by the kinase inhibitor SPP86. BMC Cancer. 2014 Nov 20;14:853.

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 , 6 months; -20°C , 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.6059 mL	18.0297 mL	36.0594 mL	90.1486 mL
	5 mM	0.7212 mL	3.6059 mL	7.2119 mL	18.0297 mL
	10 mM	0.3606 mL	1.8030 mL	3.6059 mL	9.0149 mL
	15 mM	0.2404 mL	1.2020 mL	2.4040 mL	6.0099 mL
	20 mM	0.1803 mL	0.9015 mL	1.8030 mL	4.5074 mL
	25 mM	0.1442 mL	0.7212 mL	1.4424 mL	3.6059 mL
	30 mM	0.1202 mL	0.6010 mL	1.2020 mL	3.0050 mL
	40 mM	0.0901 mL	0.4507 mL	0.9015 mL	2.2537 mL
	50 mM	0.0721 mL	0.3606 mL	0.7212 mL	1.8030 mL
	60 mM	0.0601 mL	0.3005 mL	0.6010 mL	1.5025 mL
	80 mM	0.0451 mL	0.2254 mL	0.4507 mL	1.1269 mL
	100 mM	0.0361 mL	0.1803 mL	0.3606 mL	0.9015 mL