



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: **Pemigatinib**

CAS 号: **1513857-77-6**

产品货号: **S87689**

生物活性:				
Description	Pemigatinib (INCB054828) 是一种具有口服活性的, 选择性 FGFR 抑制剂, 对于 FGFR1, FGFR2, FGFR3, FGFR4 的 IC ₅₀ 分别为 0.4 nM, 0.5 nM, 1.2 nM, 30 nM。Pemigatinib 有助于胆管癌的能力。			
IC₅₀ & Target[2]	FGFR1	FGFR2	FGFR3	FGFR4
	0.4 nM (IC ₅₀)	0.5 nM (IC ₅₀)	1.2 nM (IC ₅₀)	30 nM (IC ₅₀)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	AN3-CA	GI ₅₀	0.132 μM	Antiproliferative activity against human AN3-CA cells harboring FGFR2 K310R/N549K mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	BaF3	GI ₅₀	> 5 μM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	BaF3	GI ₅₀	> 5 μM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring TEL-FGFR4 V550E mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	BaF3	GI ₅₀	0.005 μM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring TEL-FGFR3 assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	BaF3	GI ₅₀	2.073 μM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring TEL-FGFR3-V555M mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	BaF3	GI ₅₀	4.495 μM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring TEL-FGFR4 N535K mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	J82	GI ₅₀	4.286 μM	Antiproliferative activity against human J82 cells harboring FGFR3 K652E mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	KMS-11	GI ₅₀	0.232 μM	Antiproliferative activity against human KMS-11 cells harboring FGFR3 Y373C mutant assessed as cell growth inhibition by CellTiter-Glo assay
	Sf9	IC ₅₀	0.4 nM	Inhibition of N-terminal GST tagged recombinant human FGFR2 (400 to 821 residues) expressed in an Sf9 infected baculovirus expression system using biotin-EQEDEPEGDYFEWLE-amide as substrate preincubated for 5 to 10 mins followed by substrate addition and m
	Sf9	IC ₅₀	1.7 nM	Inhibition of N-terminal His-Avi tagged recombinant human FGFR3 (447 to 761 residues) expressed in an Sf9 infected baculovirus expression system using biotin-EQEDEPEGDYFEWLE-amide as substrate



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

	preincubated for 5 to 10 mins followed by substrate addition a				
In Vitro	表达 FGFR2-CLIP1 融合的细胞对 Pemigatinib 敏感 (INCB054828; IC50 值为 10.16 nM), 而添加 N549H 突变的细胞对 Pemigatinib 具有耐药性 (IC50 值为 1527.57 nM)[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (51.28 mM; 超声助溶 (<60° C); 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	2.0513 mL	10.2564 mL	20.5128 mL
		5 mM	0.4103 mL	2.0513 mL	4.1026 mL
		10 mM	0.2051 mL	1.0256 mL	2.0513 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: 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline)					
Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.64 mM); 澄清溶液					
方案 二					
请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					
Solubility: 2.08 mg/mL (4.27 mM); 悬浊液; 超声助溶					
此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。					
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 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。					
方案 三					
请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)					
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.27 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 四					
请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil					



	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.27 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]. Arudra K, et al. Calcinosi cutis dermatologic toxicity associated with fibroblast growth factor receptor inhibitor for the treatment of Wilms tumor. J Cutan Pathol. 2018 Oct;45(10):786-790. [2]. Roskoski R Jr, et al. The role of fibroblast growth factor receptor (FGFR) protein-tyrosine kinase inhibitors in the treatment of cancers including those of the urinary bladder. Pharmacol Res. 2020 Jan;151:104567. [3]. Krook MA, et al. Tumor heterogeneity and acquired drug resistance in FGFR2-fusion-positive cholangiocarcinoma through rapid research autopsy. Cold Spring Harb Mol Case Stud. 2019 Aug 1;5(4).

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	2.0513 mL	10.2564 mL	20.5128 mL	51.2821 mL
	5 mM	0.4103 mL	2.0513 mL	4.1026 mL	10.2564 mL
	10 mM	0.2051 mL	1.0256 mL	2.0513 mL	5.1282 mL
	15 mM	0.1368 mL	0.6838 mL	1.3675 mL	3.4188 mL
	20 mM	0.1026 mL	0.5128 mL	1.0256 mL	2.5641 mL
	25 mM	0.0821 mL	0.4103 mL	0.8205 mL	2.0513 mL
	30 mM	0.0684 mL	0.3419 mL	0.6838 mL	1.7094 mL
	40 mM	0.0513 mL	0.2564 mL	0.5128 mL	1.2821 mL
	50 mM	0.0410 mL	0.2051 mL	0.4103 mL	1.0256 mL