



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: JNJ0966
CAS 号: 315705-75-0
产品货号: S88647

生物活性:

Description	JNJ0966 是一种高选择性 MMP-9 酶原抑制剂, 其 IC ₅₀ 值为 440 nM。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 440 nM (MMP-9 zymogen)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HT-1080	IC ₅₀	1 μM	Inhibition of cell invasion in human HT-1080 cells for 24 hrs by Calcein AM staining based fluorometric analysis
In Vitro	JNJ0966 是一种高选择性的 MMP-9 酶原抑制剂, IC ₅₀ 为 440 nM。在存在或不存在 10 μM JNJ0966 的情况下, proMMP-1、proMMP-2 和 proMMP-3 的激活没有显著差异, 而胰蛋白酶对 proMMP-9 的激活被 JNJ0966 显著减弱。将 JNJ0966 添加到反应中会导致完全加工的 MMP-9 显著减少, 并且中间物质的明显积累[1]。			
In Vivo	JNJ0966 的暴露量呈剂量依赖性, 10 mg/kg 剂量的血浆和脑浓度分别为 77.5 ± 31.1 ng/mL (215 nM) 和 481.6 ± 162.5 ng/g (~1336 nM), 而 30-mg/kg 剂量在血浆中达到 293.6 ± 118.4 ng/mL (815 nM), 在脑中达到 1394.0 ± 649.1 ng/g (~3867 nM)。JNJ0966 优先在脑内分布, 10 mg/kg 剂量的脑/血浆比率为 6.2, 30 mg/kg 剂量为 4.7[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (277.43 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
		1 mM	2.7743 mL	13.8715 mL
		5 mM	0.5549 mL	2.7743 mL
		10 mM	0.2774 mL	1.3872 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.94 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 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 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.94 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]. Scannevin RH, et al. Discovery of a highly selective chemical inhibitor of matrix metalloproteinase-9 (MMP-9) that allosterically inhibits zymogen activation. J Biol Chem. 2017 Oct 27;292(43):17963-17974.

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	2.7743 mL	13.8715 mL	27.7431 mL	69.3577 mL
	5 mM	0.5549 mL	2.7743 mL	5.5486 mL	13.8715 mL
	10 mM	0.2774 mL	1.3872 mL	2.7743 mL	6.9358 mL
	15 mM	0.1850 mL	0.9248 mL	1.8495 mL	4.6238 mL
	20 mM	0.1387 mL	0.6936 mL	1.3872 mL	3.4679 mL
	25 mM	0.1110 mL	0.5549 mL	1.1097 mL	2.7743 mL
	30 mM	0.0925 mL	0.4624 mL	0.9248 mL	2.3119 mL
	40 mM	0.0694 mL	0.3468 mL	0.6936 mL	1.7339 mL
	50 mM	0.0555 mL	0.2774 mL	0.5549 mL	1.3872 mL
	60 mM	0.0462 mL	0.2312 mL	0.4624 mL	1.1560 mL
	80 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3468 mL	0.8670 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1387 mL	0.2774 mL	0.6936 mL