



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: **ZUN97585; FGFR1/DDR2 inhibitor 1**

CAS 号: **2308497-58-5**

产品货号: **S89207**

生物活性:				
Description	FGFR1/DDR2 inhibitor 1 是具有口服活性的成纤维细胞生长因子受体 1 (FGFR1) 和盘状蛋白域受体 2 (DDR2) 的抑制剂, 其对 FGFR1 和 DDR2 的 IC50 值分别为 31.1 nM、3.2 nM。具有抗肿瘤活性。			
IC50 & Target[1]	FGFR1 31.1 nM (IC50)	DDR2 3.2 nM (IC50)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	KG-1	IC50	108.4 nM	Antiproliferative activity against FGFR1 fused human KG1 cells after 72 hrs by CCK8 assay
	KG-1	IC50	108.4 nM	Antiproliferative activity against human KG1 cells after 72 hrs by CCK8 assay
	NCI-H2286	IC50	93 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H2286 cells after 72 hrs by CCK8 assay
	NCI-H2286	IC50	93 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H2286 cells harboring DDR2 mutation after 72 hrs by CCK8 assay
	NCI-H716	IC50	31.8 nM	Antiproliferative activity against FGFR2 amplified human NCI-H716 cells after 72 hrs by CCK8 assay
	SNU-16	IC50	93.4 nM	Antiproliferative activity against FGFR2 amplified human SNU16 cells after 72 hrs by CCK8 assay
In Vitro	FGFR1/DDR2 inhibitor 1 (compound 11k) (25-200 μ M; 2 hours) shows significant inhibition of FGFR2 phosphorylation in a dose-dependent manner in SNU16 cells. FGFR1/DDR2 inhibitor 1 shows (60-250 μ M; 2 hours) significant inhibition of DDR2 phosphorylation in a dose-dependent manner in H2286 cells[1].			
	FGFR1/DDR2 inhibitor 1 significantly inhibits the proliferation of FGFR-driven cancer cell lines with IC50s of 108.4, 93.4, 31.8 and 306.6 nM against KG-1, SNU-16, NCI-H716 and UMUC14 respectively. FGFR1/DDR2 inhibitor 1 demonstrates substantially activity against the DDR2-driven cancer cell line NCI-H2286 (93.0 nM)[1]。			
In Vivo	FGFR1/DDR2 inhibitor 1 (10-20 mg/kg; p.o.; once daily for 7 days) has profound anti-tumor efficacy in NCI-H1581 tumor model[1].			
	SCID mice bearing NCI-H2286 tumors were randomized and treated with FGFR1/DDR2 inhibitor 1 at doses of 10 mg/kg for 10 consecutive days. FGFR1/DDR2 inhibitor 1 could suppress tumor growth with tumor growth inhibition rates (TGI) of 82.8%[1]。			
	Animal Model:		Nude mice bearing NCI-H1581 tumors[1]	
	Dosage:		10 or 20 mg/kg	
	Administration:		P.o.; once daily for 7 days	
	Result:		Suppressed tumor growth in a dose-dependent manner with tumor growth inhibition rates (TGI) of 59.7% and 98.1% at doses of 10 and 20 mg/kg, respectively.	
	细胞实验:			
Solvent&Solubility	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (498.50 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	1.9940 mL	9.9701 mL	19.9402 mL
		5 mM	0.3988 mL	1.9940 mL	3.9880 mL
		10 mM	0.1994 mL	0.9970 mL	1.9940 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.15 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 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 (4.15 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]. Wang Q, et al. Discovery and optimization of a series of 3-substituted indazole derivatives as multi-target kinase inhibitors for the treatment of lung squamous cell carcinoma. Eur J Med Chem. 2019 Feb 1;163:671-689.				

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	1.9940 mL	9.9701 mL	19.9402 mL	49.8504 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: shyyw@sina.com

	5 mM	0.3988 mL	1.9940 mL	3.9880 mL	9.9701 mL
	10 mM	0.1994 mL	0.9970 mL	1.9940 mL	4.9850 mL
	15 mM	0.1329 mL	0.6647 mL	1.3293 mL	3.3234 mL
	20 mM	0.0997 mL	0.4985 mL	0.9970 mL	2.4925 mL
	25 mM	0.0798 mL	0.3988 mL	0.7976 mL	1.9940 mL
	30 mM	0.0665 mL	0.3323 mL	0.6647 mL	1.6617 mL
	40 mM	0.0499 mL	0.2493 mL	0.4985 mL	1.2463 mL
	50 mM	0.0399 mL	0.1994 mL	0.3988 mL	0.9970 mL
	60 mM	0.0332 mL	0.1662 mL	0.3323 mL	0.8308 mL
	80 mM	0.0249 mL	0.1246 mL	0.2493 mL	0.6231 mL
	100 mM	0.0199 mL	0.0997 mL	0.1994 mL	0.4985 mL



源叶