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：shyysw@sina.com

产品名称：EGFR-IN-11
CAS 号：2463200-44-2
产品货号：S89874

生物活性：

Description	EGFR-IN-11 is a fourth-generation EGFR-tyrosine kinase inhibitor (EGFR-TKI) with an IC50 of 18 nM for triple mutant EGFRL858R/T790M/C797S. EGFR-IN-11 significantly suppresses the EGFR phosphorylation, induce the apoptosis, and arrest cell cycle at G0/G1[1].
IC50 & Target	$EGFRL^{858R/T790M/C797S}$ 18 nM (IC50)
In Vitro	EGFR-IN-11 (Compound D9; 0.0001-10 μM; 72 hours) shows significantly potent anti-proliferation against HCC827 and H1975 cell lines with IC50s of 0.88 nM and 0.20 μM, respectively[1]. EGFR-IN-11 (0.01-1.00 μM for HCC827 cells; 0.1-10.00 μM for H1975 and A549 cells; 8 hours) suppresses EGFR phosphorylation in a concentration-dependent manner in the HCC827, H1975 and A549 cell line[1]. EGFR-IN-11 (1 μM; 24 h) potently induces the apoptosis of HCC827 cells.[1] EGFR-IN-11 (1 μM; 24 h) induces cell cycle arrests in HCC827 cell[1].

Cell Proliferation Assay[1]

Cell Line:	Human lung cancer cell lines HCC827 ($EGFR^{Del\ E746-A750}$), H1975 ($EGFR^{L858R/T790M}$) and A549 (EGFRWT); epidermoid carcinoma cell line A431 (EGFRWT)
Concentration:	0.0001, 0.0003, 0.001, 0.003, 0.01, 0.1, 1, 10 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Inhibited HCC827 H1975 A549 cells proliferation with IC50s of 0.88 ±0.09 nM, 0.20±0.01 μM, 2.91±0.61 μM, and >10 μM, respectively.

Western Blot Analysis[1]

Cell Line:	HCC827, H1975 and A549 cells
Concentration:	1.00, 0.10 and 0.01 μM for HCC827 cells; 10.00, 1.00 and 0.10 μM for H1975 and A549 cells
Incubation Time:	8 hours
Result:	Suppressed EGFR phosphorylation in a concentration-dependent manner. EGFR phosphorylation in the HCC827 cell line was more remarkably suppressed than in the H1975 and A549 cell lines.

Apoptosis Analysis[1]

Cell Line:	HCC827 cells
Concentration:	1 μM
Incubation Time:	24 hours
Result:	The percentages of apoptotic cells is 56.91%.

Cell Cycle Analysis[1]

Cell Line:	HCC827 cells
Concentration:	1 μM
Incubation Time:	24 hours

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：shyysw@sina.com

	Result: The number of HCC827 cells in G0/G1 phase was increased significantly.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：125 mg/mL (217.88 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	1.7430 mL	8.7152 mL	17.4304 mL
	5 mM	0.3486 mL	1.7430 mL	3.4861 mL
	10 mM	0.1743 mL	0.8715 mL	1.7430 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.63 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 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 ddH₂ O 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% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.63 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]. Lei H, et al. Discovery of novel 9-heterocyclyl substituted 9H-purines as L858R/T790M/C797S mutant EGFR tyrosine kinase inhibitors. Eur J Med Chem. 2019 Nov 16:111888.

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。

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：shyysw@sina.com

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	1.7430 mL	8.7152 mL	17.4304 mL	43.5760 mL
	5 mM	0.3486 mL	1.7430 mL	3.4861 mL	8.7152 mL
	10 mM	0.1743 mL	0.8715 mL	1.7430 mL	4.3576 mL
	15 mM	0.1162 mL	0.5810 mL	1.1620 mL	2.9051 mL
	20 mM	0.0872 mL	0.4358 mL	0.8715 mL	2.1788 mL
	25 mM	0.0697 mL	0.3486 mL	0.6972 mL	1.7430 mL
	30 mM	0.0581 mL	0.2905 mL	0.5810 mL	1.4525 mL
	40 mM	0.0436 mL	0.2179 mL	0.4358 mL	1.0894 mL
	50 mM	0.0349 mL	0.1743 mL	0.3486 mL	0.8715 mL
	60 mM	0.0291 mL	0.1453 mL	0.2905 mL	0.7263 mL
	80 mM	0.0218 mL	0.1089 mL	0.2179 mL	0.5447 mL
	100 mM	0.0174 mL	0.0872 mL	0.1743 mL	0.4358 mL