



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: JCN037
CAS 号: 2305154-31-6
产品货号: S89994

生物活性:

Description	JCN037 (JGK037) is non-covalent and BBB-penetrant EGFR tyrosine kinase inhibitor, with IC50 values of 2.49 nM, 3.95 nM, 4.48 nM for EGFR, p-wtEGFR and pEGFRvIII, respectively[1].				
IC50 & Target	2.49 nM (EGFR), 3.95 nM (p-wtEGFR), 4.48 nM (pEGFRvIII)[1].				
In Vitro	JCN037 exhibits GI50 values of 329 nM and 1116 nM in HK301 cells and GBM39 cells, respectively[1]. Cell Line: GBM39 and GS025 cells. Concentration: 0-3333 nM Incubation Time: Result: Downregulated pEGFRvIII, p Akt, p-ERK, and p-S6 protein levels, significantly.				
In Vivo	JCN037 (compound 5) exhibits low oral bioavailability due to a rapid hydroxylation of the fused 1,4-dioxane ring, suggesting first pass metabolism[1]. JCN037 (compound 5, 300 mg/kg, BID) treatment provides a significant survival benefit, whereby median survival increased by 47% from 37.5 days to 55 days with 5 treatment[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (132.92 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.6583 mL	13.2915 mL	26.5830 mL
		5 mM	0.5317 mL	2.6583 mL	5.3166 mL
		10 mM	0.2658 mL	1.3292 mL	2.6583 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% Corn Oil Solubility: ≥ 6.25 mg/mL (16.61 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 6.25 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 62.5 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]. Jonathan E. Tsang, et al. Development of a Potent Brain-Penetrant EGFR Tyrosine Kinase Inhibitor against Malignant Brain Tumors. ACS Med. Chem. Lett. 2020. May 1.				



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

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	2.6583 mL	13.2915 mL	26.5830 mL	66.4575 mL
	5 mM	0.5317 mL	2.6583 mL	5.3166 mL	13.2915 mL
	10 mM	0.2658 mL	1.3292 mL	2.6583 mL	6.6458 mL
	15 mM	0.1772 mL	0.8861 mL	1.7722 mL	4.4305 mL
	20 mM	0.1329 mL	0.6646 mL	1.3292 mL	3.3229 mL
	25 mM	0.1063 mL	0.5317 mL	1.0633 mL	2.6583 mL
	30 mM	0.0886 mL	0.4431 mL	0.8861 mL	2.2153 mL
	40 mM	0.0665 mL	0.3323 mL	0.6646 mL	1.6614 mL
	50 mM	0.0532 mL	0.2658 mL	0.5317 mL	1.3292 mL
	60 mM	0.0443 mL	0.2215 mL	0.4431 mL	1.1076 mL
	80 mM	0.0332 mL	0.1661 mL	0.3323 mL	0.8307 mL
	100 mM	0.0266 mL	0.1329 mL	0.2658 mL	0.6646 mL