



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: JNJ-10198409

CAS 号: 627518-40-5

产品货号: Y49017

生物活性:

Description	JNJ-10198409 is a relatively selective, orally active, and ATP competitive PDGF-RTK (platelet-derived growth factor receptor tyrosine kinase) inhibitor (IC50=2 nM). It is a dual-mechanism, antiangiogenic, and tumor cell antiproliferative agent. JNJ-10198409 has good activity against PDGFR-β kinase (IC50=4.2 nM) and PDGFR-α kinase (IC50=45 nM)[1][2].				
IC50 & Target	PDGFRβ 4.2 nM (IC50)	PDGFRα 45 nM (IC50)			
In Vitro	JNJ-10198409 在八种人类肿瘤细胞系中的六种中具有有效的抗增殖活性 (IC50<0.033 μM), 并且是 c-Abl 激酶的有效抑制剂 (IC50 =22 nM)[1][2].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (256.13 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	3.0737 mL	15.3685 mL	30.7371 mL
		5 mM	0.6147 mL	3.0737 mL	6.1474 mL
		10 mM	0.3074 mL	1.5369 mL	3.0737 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 (6.39 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% (20% SBE-β -CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.39 mM); 澄清溶液					



	此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \mu\text{L}$ 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。
参考文献	[1]. D'Andrea MR, et al. Validation of in vivo pharmacodynamic activity of a novel PDGF receptor tyrosine kinase inhibitor using immunohistochemistry and quantitative image analysis. Mol Cancer Ther. 2005 Aug;4(8):1198-204. [2]. Ho CY, et al. (6,7-Dimethoxy-2,4-dihydroindeno[1,2-c]pyrazol-3-yl)phenylamines: platelet-derived growth factor receptor tyrosine kinase inhibitors with broad antiproliferative activity against tumor cells. J Med Chem. 2005 Dec 29;48(26):8163-73.

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	3.0737 mL	15.3685 mL	30.7371 mL	76.8427 mL
	5 mM	0.6147 mL	3.0737 mL	6.1474 mL	15.3685 mL
	10 mM	0.3074 mL	1.5369 mL	3.0737 mL	7.6843 mL
	15 mM	0.2049 mL	1.0246 mL	2.0491 mL	5.1228 mL
	20 mM	0.1537 mL	0.7684 mL	1.5369 mL	3.8421 mL
	25 mM	0.1229 mL	0.6147 mL	1.2295 mL	3.0737 mL
	30 mM	0.1025 mL	0.5123 mL	1.0246 mL	2.5614 mL
	40 mM	0.0768 mL	0.3842 mL	0.7684 mL	1.9211 mL
	50 mM	0.0615 mL	0.3074 mL	0.6147 mL	1.5369 mL
	60 mM	0.0512 mL	0.2561 mL	0.5123 mL	1.2807 mL
	80 mM	0.0384 mL	0.1921 mL	0.3842 mL	0.9605 mL
	100 mM	0.0307 mL	0.1537 mL	0.3074 mL	0.7684 mL