

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	E10015
产品名称:	Enasidenib

产品简介:

一种有效的选择性 IDH2 (异柠檬酸脱氢酶 2) 抑制剂, 具有潜在的抗癌活性。	
靶点:	IDH2
体外研究:	
Enasidenib (AG-221) 可逆转突变体 IDH2 对突变体干细胞/祖细胞中 DNA 甲基化的影响。 Enasidenib 诱导分化并损害 IDH2 突变白血病细胞的自我更新, 同时抑制 Flt3ITD 可进一步增强这种作用。 Enasidenib (AG-221) 处理诱导白血病细胞在 2 周时分化。	
体内研究:	
Enasidenib (AG-221) 处理可显著提高 IDH2 突变型急性髓性白血病 (AML) 原代异种移植小鼠模型的存活率。 Enasidenib (AG-221) 是一种突变 IDH2 抑制剂, 可重塑 IDH2 突变细胞的表现遗传状态, 并在体内诱导 IDH2 突变 AML 模型中自我更新/分化的改变。Enasidenib 处理(10mg/kg 或 100mg/kg bid) 导致体内 2-HG 减少 (比处理前水平低 96.7%)。此外, Enasidenib 处理可恢复被突变体 IDH2 表达抑制的巨核细胞-红细胞祖细胞 (MEP) 分化 (平均 MEP% 平均值, 39% Veh 对比 50% AG-221)。Enasidenib 疗法可逆转突变体 IDH2 的作用; 观察到 DNA 甲基化显著减少, 包括 180 个基因在处理后的具有 20 个或更多低甲基化的差异甲基化胞嘧啶 (DMC)。Enasidenib (100mg/kg bid) 处理植入 Mx1-Cre IDH2R140QFlt3ITD AML 细胞的小鼠显著降低 2-羟基戊二酸 (2-HG) 水平, 与目标值一致抑制。Enasidenib 抑制突变体 IDH2 介导的 2-HG 产生。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
溶于 DMSO(100mg/mL) 和乙醇			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.1125 mL	10.5623 mL	21.1247 mL
5 mM	0.4225 mL	2.1125 mL	4.2249 mL
10 mM	0.2112 mL	1.0562 mL	2.1125 mL
储备液的保存方式: -80° C, 1 year; -20° C, 6 months。			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.39 mM); 悬浊液; 超声加热助溶 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。			



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→ 45% Saline

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.64 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.64 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.25 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 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

注: 工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

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。

四、动物实验

动物模型:	携带 IDH2 突变的白血病小鼠模型
剂量:	10mg/kg or 100mg/kg bid
给药处理:	--

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20℃

