

## 产品说明书

26 版

## 基本信息

|       |        |
|-------|--------|
| 产品编号: | S70440 |
| 产品名称: | 塞利尼索   |

## 产品简介:

|                                                                                                                                                        |      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------|
| 一种口服有效的、选择性的 CRM1 抑制剂。                                                                                                                                 |      |
| 靶点:                                                                                                                                                    | CRM1 |
| 体外研究:                                                                                                                                                  |      |
| 作为 KPT-185 的临床候选类似物, KPT-330 对 T-ALL 细胞的活力表现出相似的作用, 并引发快速的细胞凋亡反应。KPT-330 还减少 MOLT-4、Jurkat、HBP-ALL、KOPTK-1、SKW-3 和 DND-41 细胞系的细胞生长, IC50 值为 34-203 nM。 |      |
| 体内研究:                                                                                                                                                  |      |
| Selinexor (KPT-330) 在体内显著抑制 T-ALL 细胞 (MOLT-4) 和 AML 细胞 (MV4-11) 的生长, 对正常造血细胞几乎没有毒性。                                                                    |      |
| 在具有弥漫性人类 MM 骨损伤的 SCID 小鼠中, KPT-330 抑制 MM 诱导的骨溶解并延长存活期。此外, KPT-330 通过阻断 RANKL 诱导的 NF- $\kappa$ B 和 NFATc1 直接损害破骨细胞生成和骨吸收, 对成骨细胞和 BMSCs 的影响最小。           |      |

## 使用方法 (供参考):

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |           |            |            |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|------------|------------|
| 一: 体外实验                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |           |            |            |
| DMSO: 溶于 DMSO (30mg/mL)                                                                                                                                                                                                                                                                                          |           |            |            |
| 浓度 \ 质量<br>溶液体积                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 1mg       | 5mg        | 10mg       |
| 1 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 2.2558 mL | 11.2788 mL | 22.5576 mL |
| 5 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 0.4512 mL | 2.2558 mL  | 4.5115 mL  |
| 10 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 0.2256 mL | 1.1279 mL  | 2.2558 mL  |
| 储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。                                                                                                                                                                                                                                                                       |           |            |            |
| 二: 体内实验                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |           |            |            |
| 1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% Corn Oil<br>Solubility: $\geq 2.5$ mg/mL (5.64 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq 2.5$ 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。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 $\mu$ L 玉米油中, 混合均匀。                                                                            |           |            |            |
| 2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline<br>Solubility: $\geq 2.08$ mg/mL (4.69 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq 2.08$ mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 $\mu$ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 $\mu$ L 生理盐水 定容至 1 mL。 |           |            |            |



3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: 2.08 mg/mL (4.69 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。

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。

### 三、细胞实验

细胞系：MOLT-4, Jurkat, HBP-ALL, KOPTK-1, SKW-3, 和 DND-41 细胞系

浓度：~1 μM

处理时间：72 小时

方法：细胞系培养在 RPMI1640 培养基中，补充 10%胎牛血清和青霉素/链霉素。Cell Titer Glo 测定法用于评估 DMSO 或 KPT-330 处理的细胞生存力。细胞按每孔 10000 个接种在 96 孔板中，与 DMSO 或浓度不断增加的 KPT-330 温育。72 小时后，测量 KPT-330 处理的细胞存活率，记为对照组 DMSO 处理细胞的百分比。使用 MSCV-IRES-GFP 逆转录病毒表达系统获得过表达 BCL2 的 Jurkat 细胞。感染 BCL2 或对照载体病毒的 Jurkat 细胞通过流式细胞仪进行排序，使用 BCL2 抗体，通过 Western blot 分析验证 BCL2 的表达。

### 四、动物实验

动物模型：T-ALL 和 AML 移植瘤小鼠模型

剂量：20 -25 mg/kg

给药处理：口服处理

### 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℃

