

Enasidenib (AG-221)

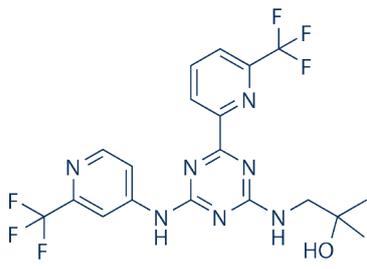
产品编号：MB4312

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

| | | | |
|---------------|-------------------------------|-------------|---|
| 分子式 | C19H17F6N7O | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 473.38 | | |
| CAS No. | 1446502-11-9 | | |
| 储存条件 | -20°C，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO：100 mg/mL (211.25 mM) | | |
| | Water：Insoluble | | |
| | Ethanol：100 mg/mL (211.25 mM) | | |
| 注意事项 | 溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。 | | |
| 其他说明 | 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。 | | |

简介：Enasidenib 是可口服，可逆，选择性的 IDH2 突变酶抑制剂。

别名：恩西地平；AG-221；2-Propanol, 2-methyl-1-[[4-[6-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]-6-[[2-(trifluoromethyl)-4-pyridinyl]amino]-1,3,5-triazin-2-yl]amino]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：100 mg/mL (211.25 mM)；Water：Insoluble；Ethanol：100 mg/mL (211.25 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

| | |
|------|--|
| 产品描述 | AG-221 (Enasidenib) 是一种新型有效的、具有选择性的 IDH2 突变酶的可逆抑制剂，IC50 为 12 nM。 |
| 靶点 | IDH2 12 nM |
| 体外研究 | AG-221 降低>90%的 2-HG 水平，在体外逆转组蛋白和 DNA 的过度甲基化；在白血病细 |

| | |
|-------------|--|
| | 胞中诱导细胞分化。 |
| 体内研究 | AG-221 能够有效降低移植小鼠骨髓、血浆和尿液中 2-HG 水平。AG-221 的处理还可诱导剂量依赖式的、统计上显著的生存益处。AG-221 处理、细胞分化后，人类特异的 CD45+ 胚细胞爆发式增殖。AG-221 还可恢复由突变体 IDH2 表达抑制的 MEP 分化、逆转突变体 IDH2 在突变干/祖细胞中对 DNA 甲基化效应。临床实验中，IDH2 抑制剂和其他靶向 AML 的疗法相结合，对于提高治疗效果是十分必要的。 |

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Enasidenib 是可口服，可逆，选择性的 IDH2 突变酶抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体 浓度 | 质 量 积 | | |
|---------|-----------|------------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 2.1125 mL | 10.5623 mL | 21.1247 mL |
| 5 mM | 0.4225mL | 2.1125 mL | 4.2249 mL |
| 10 mM | 0.2112 mL | 1.0562 mL | 2.1125 mL |
| 50 mM | 0.0422 mL | 0.2112 mL | 0.4225 mL |

经典实验操作（仅供参考）

| | |
|-------------|---|
| 动物实验 | <p>Animal Models: 携带 IDH2 突变的白血病小鼠模型</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 10mg/kg or 100mg/kg bid</p> <p>Administration: --</p> |
|-------------|---|

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

| 物种 | 体重(KG) | 体表面积(M2) | Km 系数 |
|----|--------|----------|-------|
| 狒狒 | 12 | 0.6 | 20 |
| 狗 | 10 | 0.5 | 20 |
| 猴 | 3 | 0.24 | 12 |
| 兔 | 1.8 | 0.15 | 12 |
| 豚鼠 | 0.4 | 0.05 | 8 |
| 大鼠 | 0.15 | 0.025 | 6 |
| 仓鼠 | 0.08 | 0.02 | 5 |
| 小鼠 | 0.02 | 0.007 | 3 |

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

| 标示重量范围 | 误差范围 |
|--------|-------|
| 1-20MG | 0.1MG |

| | |
|----------|-------|
| 50-500MG | 1MG |
| >1G | 3-5MG |

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。