

Enasidenib mesylate(AG-221)

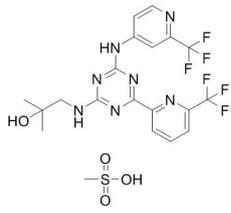
产品编号: MB4358

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5MG; 25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₂₁ F ₆ N ₇ O ₄ S	结构式	
分子量	569.48		
CAS No.	1650550-25-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : ≥ 100 mg/mL(175.60 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 mesylate 是一种有效的, 可口服的, 可逆的, 选择性的 IDH2 突变酶抑制剂。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:DMSO : ≥ 100 mg/mL(175.60 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Enasidenib mesylate is a first-in-class, oral, potent, reversible, selective inhibitor of the IDH2 mutant enzymes.
体外研究	Enasidenib (AG-221) reverses the effects of mutant IDH2 on DNA methylation in mutant stem/progenitor cells. Enasidenib induces differentiation and impairs self-renewal of IDH2-mutant leukemia cells, effects that are further enhanced by simultaneous inhibition of Flt3ITD. Enasidenib (AG-221) therapy induces differentiation of leukemic cells, with an increase in the CD11b+ population and a decrease in the c-Kit+ population in the peripheral blood at 2 wks.
体内研究	Treatment with enasidenib (AG-221) significantly improves survival in an IDH2-mutant acute myeloid leukemia (AML) primary xenograft mouse model. Enasidenib (AG-221), a mutant IDH2 inhibitor, remodels the epigenetic state of IDH2-mutant cells and induces alterations in self-renewal/differentiation in IDH2-mutant AML model in vivo. Enasidenib treatment (10 mg/kg or 100 mg/kg bid) leads to a reduction in 2-HG in vivo (96.7% below pre-treatment levels). Moreover, Enasidenib treatment restores megakaryocyte-erythroid progenitor (MEP) differentiation that is suppressed by mutant IDH2 expression (mean MEP% mean, 39% Veh vs 50% AG-221).

Enasidenib therapy reverses the effects of mutant IDH2; a significant reduction is observed in DNA methylation, including 180 genes that have 20 or more hypomethylated differentially methylated cytosines (DMCs) following treatment. Enasidenib (100 mg/kg bid) treatment of mice engrafted with Mx1-Cre IDH2R140QFlt3ITD AML cells markedly reduces 2-hydroxyglutarate (2-HG) levels consistent with on target inhibition. Enasidenib inhibits mutant IDH2-mediated 2-HG production.

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5482	A771726 (Teriflunomide)
MB3230	AG-120(Ivosidenib)
MB6908	AGI-5198; IDHC35

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。

储液配置: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热(在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7560 mL	8.7799 mL	17.5599 mL
5 mM	0.3512 mL	1.7560 mL	3.5120 mL
10 mM	0.1756 mL	0.8780 mL	1.7560 mL

【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, 否则会严重影响化合物活性, 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。