

AGI5198 ; IDH-C35 ; AGI-5198 ; IDHC35

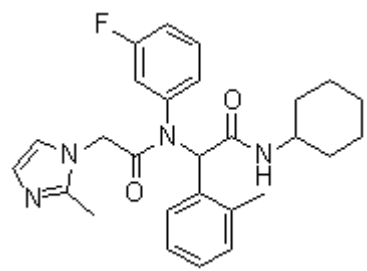
产品编号 : MB6908

质量标准 : >98%

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C27H31FN4O2	结 构 式	
分子量	462.56		
CAS No.	1355326-35-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 24 mg/mL (51.88 mM) Water Insoluble Ethanol : 14 mg/mL (30.26 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 : AGI-5198 是有效和选择性的突变体 IDH1R132H 抑制剂。

别名 : IDH-C35 ; 1H-Imidazole-1-acetamide, N-[2-(cyclohexylamino)-1-(2-methylphenyl)-2-oxoethyl]-N-(3-fluorophenyl)-2-methyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 24 mg/mL (51.88 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 14 mg/mL (30.26 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	AGI-5198 是第一个高效的, 选择性的 IDH1 R132H/R132C 突变型抑制剂, IC50 为 0.07 μM/0.16 μM。	
靶点	R132H-IDH1 (Cell-free assay)	R132C-IDH1

	70 nM	0.16 μM
体外研究	AGI-5198 有效抑制突变型 IDH1(R132H-IDH1 和 R132C-IDH1), 而非野生型 IDH1 (IC50>100 μM) 或任何 IDH2 亚型(R140Q, R172K, 野生型) (IC50>100 μM)。AGI-5198 作用于 TS603 胶质瘤细胞系, 具有抗肿瘤的药效, 且抑制 R-2HG 产生, 这种作用具有剂量依赖性。在几乎完全抑制 R-2HG 的条件下, AGI-5198 诱导组蛋白 H3K9me3 的去甲基化, 且诱导与胶质基因分化相关的基因表达。在全基因组 DNA 甲基化中, 抑制 mIDH1 受损的 IDH1 突变型生长, 但 IDH1 野生型胶质瘤细胞的生长没有明显的变化。	
体内研究	AGI-5198 每天按 450 mg/kg 剂量处理 R132H-IDH1 胶质瘤移植瘤, 处理三周, 抑制 50-60% 的生长, 对 IDH1 野生型胶质瘤移植瘤的生长没有影响。Ki-67 蛋白抗体染色的 AGI-5198 处理的小鼠的肿瘤减少。但是空白对照组和 AGI-5198 处理的小鼠实验组中, 肿瘤中裂解的 caspase-3 显示无显著差异。	

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)

MB3230	AG-120(Ivosidenib)
--------	--------------------

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。AGI-5198 是有效和选择性的突变体 IDH1R132H 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		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1619 mL	10.8094 mL	21.6188 mL
5 mM	0.4324 mL	2.1619 mL	4.3238 mL
10 mM	0.2162 mL	1.0809 mL	2.1619 mL
50 mM	0.0432 mL	0.2162 mL	0.4324 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	IDH 酶活性: 化合物制备成 10 mM 储存在 DMSO 中, 在 DMSO 中稀释到终浓度为 50X, 制备成 50 μL 反应混合物。通过 NADPH 消耗实验, 测量 α-酮戊二酸到 2-羟基戊二酸的转化率, 从而测定 IDH 酶活性检测。实验中, 反应结束时, 测量剩余的辅因子, 加入催化过量的 Diaphorase 和 Resazurin, 产生与剩余 NADPH 的量成比例的荧光信号。测定异柠檬酸到 α-酮戊二酸的转化率而测定 IDH 酶活性。这两种情况下, 都在 Ex544 Em 590 处进行 Resorufin 的荧光测量。
细胞实验	Cell lines: TS603 Concentrations: 0, 23.4, 93.8, 375, 3000 nM

	Incubation Time: -- Method: 软琼脂集落形成法
动物实验	Animal Models: IDH1 突变型胶质瘤移植瘤 Formulation: 0.5% MC 和 0.2% Tween 80 Dosages: 每天 150 mg/kg, 450 mg/kg Administration: 口服饲喂

【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。