

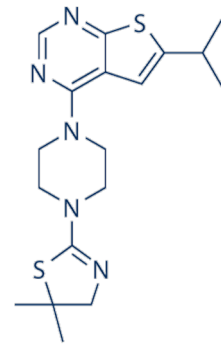
MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1078-10mM	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1078-5mg	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1078-25mg	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[4-(5,5-dimethyl-4H-1,3-thiazol-2-yl)piperazin-1-yl]-2-propan-2-ylthieno[2,3-d]pyrimidine
简称	MI-3
别名	ZINC95080576, AKOS026750578, DA-46476, KB-78854, W-6013
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₂₅ N ₅ S ₂
分子量	375.55
CAS号	1271738-59-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 19mg/ml warming; Ethanol 19mg/ml warming
溶液配制	5mg加入1.33ml DMSO, 或每3.76mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1078-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	MI-3 (Menin-MLL Inhibitor)是一种强效的menin-MLL相互作用抑制剂, IC50为648nM。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	Menin-MLL	—	—	—	—
IC50	648nM	—	—	—	—
体外研究	在HEK293细胞中, MI-2访问蛋白质靶点, 并有效抑制menin-MLL-AF9相互作用。MI-2通过下调MLL融合蛋白致癌活性必需的靶点基因的表达, 有效阻断MLL融合蛋白介导的白血病转化。对于含有不同MLL易位的人MLL白血病细胞系, MI-2也能有效阻断细胞增殖, 并诱导细胞凋亡。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	15nM FITC-MBM1和150nM menin在FP缓冲液中混合, 在黑暗中于室温下培养1小时。对于点筛选, 0.2μl的各种化合物(终浓度20μM, 1% DMSO)加入到20μl等分的蛋白质-多肽混合物中, 在384孔板上黑暗中于室温下培养1小时。为确定筛选, 板中的化合物用DMSO连续稀释, 用于滴定menin-FITC-MBM1复合物。495nm波长下激发后, 荧光偏振的改变使用PHERAstar酶标仪(BMG)在525nm下监测, 并应用于Origin 7.0程序测定IC50值。

细胞实验	
细胞系	MLL-AF9和E2A-HLF转导的小鼠BMC
浓度	~20μM
处理时间	12天
方法	MLL-AF9和E2A-HLF转导的小鼠BMC以5×10 ³ 细胞/毫升的浓度接种于12孔板, 在包含20% IMDM培养液, 1%青霉素/链霉素, IL-3和0.25% DMSO或化合物的1ml甲基纤维素培养基中培养。6天后, 菌落用100μl终浓度为1mg/ml的碘硝基氯化四氮唑蓝着色, 在37°C下培养30分钟, 并计数。对于第二轮, 菌落

	不着色，在第6天计数，细胞通过1X PBS缓冲液洗出，重悬浮于含有15% FBS, 1%青霉素/链霉素和IL-3的IMDM培养基。5×10 ³ 个细胞接种于12孔板，在含有20% IMDM培养液，1%青霉素/链霉素，IL-3和0.25% DMSO或化合物的1ml甲基纤维素培养基中培养。6天后，将菌落着色并计数。
--	-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1.Grembecka J, et al. Nat Chem Biol. 2012, 8(3), 277-284.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1078-10mM	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1078-5mg	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1078-25mg	MI-3 (Histone Methyltransferase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01