

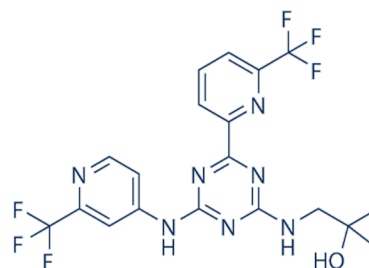
## Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7252-10mM	Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7252-5mg	Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)	5mg
SD7252-25mg	Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-methyl-1-[[4-[6-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]-6-[[2-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]amino]-1,3,5-triazin-2-yl]amino]propan-2-ol
简称	Enasidenib
别名	AG-221, CC-90007, GTPL8960, CS-5017, AK431837
中文名	N/A
化学式	C <sub>19</sub> H <sub>17</sub> F <sub>6</sub> N <sub>7</sub> O
分子量	473.38
CAS号	1446502-11-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入1.06ml DMSO, 或每4.73mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7252-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Enasidenib is a first-in-class, oral, potent, reversible, selective inhibitor of the IDH2 mutant enzyme.				
信号通路	Metabolism				
靶点	IDH2	—	—	—	—
IC50	12nM	—	—	—	—
体外研究	The compound has been demonstrated to reduce 2-HG levels by >90% and reverse histone and deoxyribonucleic acid (DNA) hypermethylation in vitro, and to induce differentiation in leukemia cell models.				
体内研究	AG-221 is able to potently reduce 2HG found in the bone marrow, plasma and urine of engrafted mice. Treatment also induced a dose dependent, statistically significant, survival benefit. A proliferative burst of the human specific CD45 <sup>+</sup> blast cells is followed by cellular differentiation as measured by the expression of CD11b, CD14 and CD15 and cell morphology after AG-221 treatment. AG-221 treatment also restores megakaryocyte-erythroid progenitor (MEP) differentiation that is suppressed by mutant IDH2 expression and reverses the effects of mutant IDH2 on DNA methylation in mutant stem/progenitor cells. Clinical trials combining IDH2 inhibitors with other targeted Aml therapies are warranted in order to increase therapeutic efficacy.				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	Murine models of IDH2-mutant leukemia
配制	N/A
剂量	10mg/kg or 100mg/kg bid
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Alan H. Shih, et al. Blood. 2014, 124:437.
2. Kate Ellwood-Yen, et al. AACR. 2014, 74(19 Sup.):3116.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD7252-10mM	Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7252-5mg	Enasidenib (Dehydrogenase抑制剂)	5mg
SD7252-25mg	Enasidenib (Dehydrogenase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:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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