



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: CC-90011
CAS 号: 2097523-60-7
产品货号: S87876

生物活性:

Description	CC-90011 benzenesulfonate 是一种有效的, 选择性的, 可逆的和具有口服活性的赖氨酸特异性脱甲基酶-1 (LSD1) 抑制剂, IC50 为 0.25 nM。CC-90011 benzenesulfonate 对 LSD2, MOA-A 和 MAO-B 的酶抑制作用较小。CC-90011 benzenesulfonate 诱导急性髓细胞性白血病 (AML)和小细胞肺癌 (SCLC) 细胞分化, 并具有有效的抗癌活性。				
IC50 & Target	KDM1/LSD1				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	IMR-90	EC50	> 10 μM	Anti-proliferative activity in human IMR-90 cells incubated for 168 hrs by MTS assay	
	Kasumi 1	EC50	2 nM	Anti-proliferative activity in human Kasumi 1 cells incubated for 168 hrs by MTS assay	
In Vitro	CC-90011 (化合物 11) 在 THP-1 细胞系中有效诱导靶向细胞分化标志物 CD11b, EC50 为 7 nM, 在 AML kasumi-1 细胞中具有抗增殖活性, EC 50 2 nM[1]。				
	在 CC-90011 处理 (4 天) 时观察到 GRP 以剂量依赖方式和药理学方式受到抑制有效浓度 (EC50=3 nM (H209 细胞) 和 4 nM (H1417 细胞))。CC-90011 (12 天) 处理 SCLC 细胞产生与 GRP 抑制相关的有效抗增殖活性 (EC50=6 nM (H1417 细胞))[1]。				
In Vivo	CC-90011 (5 mg/kg; 口服给药; 每天; 持续 30 天) 可抑制患者来源的异种移植 SCLC 模型中的肿瘤生长[1]。				
	在 SCLC 人肿瘤异种移植 (H1417) 小鼠模型中, CC-90011 (每天一次; 持续 4 天) 导致 GRP mRNA 水平在 2.5 mg/kg 下的强烈下调和 GRP 在 5 mg/kg 下的最大抑制[1]。				
	静脉注射后, CC-90011 (化合物 11; 5 mg/kg) 的全身清除率为 32.4 mL/min/kg, 消除半衰期为 2 小时, 分布容积 >7.5 L/kg。CC-90011 (Compound 11; 5 mg/kg) 口服后易被吸收, AUC0-24h 为 1.8 μM · h, Cmax 为 0.36 μM, 口服生物利用度为 32%[1]。				
	Animal Model:		BALB/c nude mice bearing small cell lung carcinoma (SCLC)[1]		
	Dosage:		5 mg/kg		
	Administration:		Oral administration; daily; for 30 days		
	Result:		Showed a tumor growth inhibition (TGI) of 78% at 5 mg/kg with no body weight loss.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (82.02 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.6403 mL	8.2016 mL	16.4031 mL
		5 mM	0.3281 mL	1.6403 mL	3.2806 mL
		10 mM	0.1640 mL	0.8202 mL	1.6403 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。					
储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。					



	动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.41 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.41 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。
参考文献	[1]. Toufike Kanouni, et al. Discovery of CC-90011: A Potent and Selective Reversible Inhibitor of Lysine Specific Demethylase 1 (LSD1). J Med Chem. 2020 Dec 10;63(23):14522-14529.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year (sealed storage, away from moisture)。-80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.6403 mL	8.2016 mL	16.4031 mL	41.0078 mL
	5 mM	0.3281 mL	1.6403 mL	3.2806 mL	8.2016 mL
	10 mM	0.1640 mL	0.8202 mL	1.6403 mL	4.1008 mL
	15 mM	0.1094 mL	0.5468 mL	1.0935 mL	2.7339 mL
	20 mM	0.0820 mL	0.4101 mL	0.8202 mL	2.0504 mL
	25 mM	0.0656 mL	0.3281 mL	0.6561 mL	1.6403 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	30 mM	0.0547 mL	0.2734 mL	0.5468 mL	1.3669 mL
	40 mM	0.0410 mL	0.2050 mL	0.4101 mL	1.0252 mL
	50 mM	0.0328 mL	0.1640 mL	0.3281 mL	0.8202 mL
	60 mM	0.0273 mL	0.1367 mL	0.2734 mL	0.6835 mL
	80 mM	0.0205 mL	0.1025 mL	0.2050 mL	0.5126 mL



源叶