



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: **V-9302**
CAS 号: **1855871-76-9**
产品货号: **S88524**

生物活性:					
Description	V-9302 是跨膜谷氨酰胺通量的竞争性拮抗剂。V-9302 有效选择性的靶向氨基酸转运体 ASCT2 (SLC1A5), 不是 ASCT1。V-9302 抑制了 HEK-293 细胞中由 ASCT2 介导的谷氨酰胺摄取 (IC50=9.6 μM)。				
IC50 & Target	ASCT2				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	A549	IC50	20.46 μM	Antiproliferative activity against human A549 cells assessed as reduction in cell viability after 72 hrs by MTT assay	
	C6	IC50	9 μM	Inhibition of ASCT2-mediated glutamine transport in rat C6 cells using [3H]-glutamine after 15 mins by scintillation counting	
	HEK293	IC50	9.6 μM	Inhibition of ASCT2-mediated glutamine transport in human HEK293 cells using [3H]-glutamine after 15 mins by scintillation counting	
In Vitro	V-9302 以浓度依赖性方式抑制人体细胞中 ASCT2 介导的谷氨酰胺摄取,其效力比 γ-L-谷氨酰胺-对硝基苯胺提高 100 倍[1]。 使用 V-9302 药理学阻断 ASCT2 可减弱癌细胞的生长和增殖, 增加细胞死亡, 并增加氧化应激 [1]。				
In Vivo	V-9302 (75 mg/kg; 腹腔注射; 每日一次, 连续 21 天) 可抑制 HCT-116 和 HT29 异种移植模型中的肿瘤生长[1]。 CB-839 和 V-9302 (30 mg/kg; 腹腔注射; SNU398 和 MHCC97H 细胞在 BALB/c 裸鼠中作为肿瘤异种移植瘤生长; 分别持续 20 或 15 天) 的组合在 SNU398 和 MHCC97H 异种移植模型中均表现出强烈的生长抑制作用, 而单一药物治疗则显示出适度的抗肿瘤作用[2]。 V-9302 (50 mg/kg; 腹腔注射; 每天一次, 连续 5 天) 显示肿瘤生长明显减少[3]。				
	Animal Model:		6-week old, female athymic nude mice (bearing HCT-116 (KRAS G13D) or HT29 (BRAF V600E) cell-line)[1]		
	Dosage:		75 mg/kg		
	Administration:		Intraperitoneally; daily fo 21 days		
	Result:		Prevented tumor growth.		
	Solvent&Solubility	细胞实验:			
DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (46.41 mM; 超声助溶 (<80°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)					
H2O 中的溶解度 : <0.1 mg/mL (insoluble)					
Preparing Stock Solutions		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8564 mL	9.2819 mL	18.5639 mL
		5 mM	0.3713 mL	1.8564 mL	3.7128 mL
	10 mM	0.1856 mL	0.9282 mL	1.8564 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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: ≥ 1 mg/mL (1.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 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: 1 mg/mL (1.86 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 1 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1 mg/mL (1.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Schulte ML, et al. Pharmacological blockade of ASCT2-dependent glutamine transport leads to antitumor efficacy in preclinical models. Nat Med. 2018 Feb;24(2):194-202. [2]. Jin H, et al. A powerful drug combination strategy targeting glutamine addiction for the treatment of human liver cancer. Elife. 2020;9:e56749. Published 2020 Oct 5. [3]. Edwards DN, et al. Selective glutamine metabolism inhibition in tumor cells improves antitumor T lymphocyte activity in triple-negative breast cancer. J Clin Invest. 2021;131(4):e140100.
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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8564 mL	9.2819 mL	18.5639 mL	46.4097 mL
	5 mM	0.3713 mL	1.8564 mL	3.7128 mL	9.2819 mL
	10 mM	0.1856 mL	0.9282 mL	1.8564 mL	4.6410 mL
	15 mM	0.1238 mL	0.6188 mL	1.2376 mL	3.0940 mL
	20 mM	0.0928 mL	0.4641 mL	0.9282 mL	2.3205 mL
	25 mM	0.0743 mL	0.3713 mL	0.7426 mL	1.8564 mL
	30 mM	0.0619 mL	0.3094 mL	0.6188 mL	1.5470 mL
	40 mM	0.0464 mL	0.2320 mL	0.4641 mL	1.1602 mL



源叶