



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: **VTP50469**
CAS 号: **2169916-18-9**
产品货号: **S89152**

生物活性:

Description	VTP50469 是一种有效的, 高选择性和口服活性的 Menin-MLL 相互作用抑制剂, Ki 为 104 pM。VTP50469 具有高效的抗白血病活性。				
IC50 & Target	Ki: 104 pM (Menin-MLL interaction)[1][2]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	MOLM-13	GI ₅₀	13 nM	Antiproliferative activity against human MOLM-13 cells	
	MV4-11	GI ₅₀	17 nM	Antiproliferative activity against human MV4-11 cells	
In Vitro	VTP50469 在携带 (MOLM13 (IC50: 13 nM)、THP1 (IC50: 37 nM), NOMO1 (IC50: 30 nM), ML2 (IC50 为 16 nM), EOL1 (IC50 为 20 nM), 以及小鼠 MLL-AF9 细胞 (IC50 为 15 nM) 和 ALL (KOPN8 (IC50 为 15 nM), HB11; 19 (IC36 nM 的 50)、MV4; 11 (17 nM 的 IC50)、SEMK2 (27 nM 的 IC50) 和 RS4; 11 (IC 50: 25 nM)) [1]。				
	在早期时间点, MLL-r B 细胞以剂量依赖性方式响应 VTP50469 发生细胞凋亡。MLL-r AML 细胞系在暴露于 VTP50469 后 4-6 天开始经历剂量依赖性分化[1]。				
	VTP50469 将 Menin 从蛋白质复合物中置换出来, 并抑制 MLL 的染色质占据基因。MLL 结合的丧失导致基因表达、分化和细胞凋亡发生变化[1]。				
In Vivo	VTP50469 (15-60 mg/kg; 口服; 每天两次; 28 天; NSG 小鼠) 处理在所有剂量水平上都非常有效, 并且所有处理组都具有显著的生存优势。以 30 和 60 mg/kg VTP50469 给药的小鼠可延长生存优势[1]。				
	Animal Model:		Unconditioned immunodeficient (NSG) mice with MV4;11 cells[1]		
	Dosage:		15 mg/kg, 30 mg/kg, and 60 mg/kg		
	Administration:		Oral administration; twice a day; for 28 days		
	Result:		Was highly efficacious across all dosage levels and all treatment groups had a significant survival advantage over the control group.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (158.52 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	1.5852 mL	7.9262 mL	15.8524 mL
		5 mM	0.3170 mL	1.5852 mL	3.1705 mL
10 mM		0.1585 mL	0.7926 mL	1.5852 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。-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;					



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

	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： 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.96 mM); 澄清溶液 方案 二 请依序添加每种溶剂： 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.96 mM); 澄清溶液 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.30 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 四 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.30 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。 方案 五 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.30 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，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 20.8 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]. Krivtsov AV, et al. A Menin-MLL Inhibitor Induces Specific Chromatin Changes and Eradicates Disease in Models of MLL-Rearranged Leukemia. Cancer Cell. 2019 Dec 9;36(6):660-673.e11. [2]. Andrei V. Krivtsov, et al. Abstract 4958: VTP50469 is a novel, orally available menin-MLL1 inhibitor effective against MLL-rearranged and NPM1-mutant leukemia. Cancer Reseach. July 2018. Volume 78, Issue 13 Supplement.															
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。-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	<table><tr><td>质量</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td><td>25 mg</td></tr><tr><td>溶剂体积</td><td></td><td></td><td></td><td></td></tr><tr><td>浓度</td><td></td><td></td><td></td><td></td></tr></table>	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	溶剂体积					浓度				
质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg												
溶剂体积																
浓度																



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

DMSO	1 mM	1.5852 mL	7.9262 mL	15.8524 mL	39.6310 mL
	5 mM	0.3170 mL	1.5852 mL	3.1705 mL	7.9262 mL
	10 mM	0.1585 mL	0.7926 mL	1.5852 mL	3.9631 mL
	15 mM	0.1057 mL	0.5284 mL	1.0568 mL	2.6421 mL
	20 mM	0.0793 mL	0.3963 mL	0.7926 mL	1.9815 mL
	25 mM	0.0634 mL	0.3170 mL	0.6341 mL	1.5852 mL
	30 mM	0.0528 mL	0.2642 mL	0.5284 mL	1.3210 mL
	40 mM	0.0396 mL	0.1982 mL	0.3963 mL	0.9908 mL
	50 mM	0.0317 mL	0.1585 mL	0.3170 mL	0.7926 mL
	60 mM	0.0264 mL	0.1321 mL	0.2642 mL	0.6605 mL
	80 mM	0.0198 mL	0.0991 mL	0.1982 mL	0.4954 mL
	100 mM	0.0159 mL	0.0793 mL	0.1585 mL	0.3963 mL

源叶