



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: **HM43239**
CAS 号: **2569527-64-4**
产品货号: **S89315**

生物活性:

Description	Tuspetinib (HM43239) 是具有口服活性的选择性 FLT3 抑制剂, IC50 值为 1.1 nM (FLT3 野生型)、1.8 nM (FLT3 ITD 突变型) 和 1.0 nM (FLT3 D835Y 突变型)。Tuspetinib 作为可逆的 I 型抑制剂直接抑制 FLT3 的激酶活性, 并调节 p-STAT5, p-ERK SYK, JAK1/2 和 TAK1。Tuspetinib 抑制白血病细胞的增殖, 诱导细胞凋亡 (apoptosis)。				
IC50 & Target[1]	FLT3 WT 1.1 nM (IC50)	FLT3 ITD 1.8 nM (IC50)	FLT3 D835Y 1.0 nM (IC50)		
In Vitro	Tuspetinib 有效抑制具有 FLT3 ITD 突变的急性髓性白血病细胞系的生长, 如 MV4-11 (IC50: 1.3 nM)、MOLM-13 (IC50: 5.1 nM) 和 MOLM-14 (IC50: 2.9 nM)。Tuspetinib 还抑制 KG1a 细胞 (CD34+/CD38-细胞) 增殖[1]。 Tuspetinib 诱导表达白血病干细胞 (LSC) 标记物的 KG1a 细胞发生半胱天冬酶 3/7 依赖性凋亡 (CD34+/CD38-细胞)[1]。 Tuspetinib 可有效抑制 KG1a 细胞中 SYK、STAT3 和 STAT5 的磷酸化[3]。				
In Vivo	Tuspetinib 在异种移植 MV4-11 和 MOLM-13 细胞系的小鼠模型中显示出与剂量成比例的出色抗肿瘤活性, 且没有任何显著毒性[1]。 Tuspetinib 可延长 FLT3 ITD/TKD 双突变异种移植小鼠的生存期[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (249.47 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	1.9957 mL	9.9786 mL	19.9573 mL
		5 mM	0.3991 mL	1.9957 mL	3.9915 mL
		10 mM	0.1996 mL	0.9979 mL	1.9957 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 (protect from light)。-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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.15 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。				



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 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Miyoung Lee, et.al. Abstract 804: Antitumor activity of the potent and novel FLT3 inhibitor HM43239 in acute myeloid leukemia. Cancer Res July 1 2018 (78) (13 Supplement) 804. [2]. Naval G. Daver, et.al. HM43239, a Novel Potent Small Molecule FLT3 Inhibitor, in Acute Myeloid Leukemia (AML) with FMS-like Tyrosine Kinase 3 (FLT3) Mutations: Phase 1 /2 Study. Blood 2019; 134 (Supplement_1): 1331. [3]. JiSook Kim, et.al. Abstract 1293: HM43239, a novel FLT3 inhibitor in overcoming resistance for acute myeloid leukemia. Cancer Res July 1 2019 (79) (13 Supplement) 1293.

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 (protect from light)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.9957 mL	9.9786 mL	19.9573 mL	49.8932 mL
	5 mM	0.3991 mL	1.9957 mL	3.9915 mL	9.9786 mL
	10 mM	0.1996 mL	0.9979 mL	1.9957 mL	4.9893 mL
	15 mM	0.1330 mL	0.6652 mL	1.3305 mL	3.3262 mL
	20 mM	0.0998 mL	0.4989 mL	0.9979 mL	2.4947 mL
	25 mM	0.0798 mL	0.3991 mL	0.7983 mL	1.9957 mL
	30 mM	0.0665 mL	0.3326 mL	0.6652 mL	1.6631 mL
	40 mM	0.0499 mL	0.2495 mL	0.4989 mL	1.2473 mL
	50 mM	0.0399 mL	0.1996 mL	0.3991 mL	0.9979 mL
	60 mM	0.0333 mL	0.1663 mL	0.3326 mL	0.8316 mL
	80 mM	0.0249 mL	0.1247 mL	0.2495 mL	0.6237 mL
	100 mM	0.0200 mL	0.0998 mL	0.1996 mL	0.4989 mL