



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: **DS-3201**
CAS 号: **1809336-39-7**
产品货号: **S89697**

生物活性:

Description	Valemetostat (DS-3201), a first-in-class EZH1/2 dual inhibitor with IC50 values <10 nM. Valemetostat can be used for the research of relapsed/refractory peripheral T-cell lymphoma[1][2][3].				
IC50 & Target	EZH1				
In Vitro	Valemetostat (1-1000 nM) 强烈且特异地抑制 EZH1 和 EZH2, IC50 值小于 10 nM[3]。 Valemetostat (100 nM; 7 d) 有效去除 H3K27me3 并防止 H3K27me3 意外增加[3]。 Valemetostat (0.1-100 nM; 7 d) 通过低剂量给药有效抑制敏感淋巴瘤类型中的 H3K27me3[3]。				
In Vivo	Valemetostat (0.01 mg/g; 腹腔注射; 一次) 可防止运动训练后 H3K27me3 的变化[2]。 Animal Model: Male C57BL/6J mice with chronic and acute running exercise or without exercise[1] Dosage: 0.01 mg/g Administration: Intraperitoneal injection; 0.01 mg/g; 30 min before the start of running exercise Result: Significantly increased the level of H3K27me3 , slightly decreased EZH1 level , upregulated the EZH2 level and increased the level of phosphorylated AMPK after exercise. Repressed myonuclear H3K27me3 accumulation during training and caused a failure of adaptive changes.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 70 mg/mL (143.44 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	2.0491 mL	10.2455 mL	20.4910 mL
		5 mM	0.4098 mL	2.0491 mL	4.0982 mL
		10 mM	0.2049 mL	1.0245 mL	2.0491 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。 -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: ≥ 5 mg/mL (10.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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 ddH₂ O 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: ≥ 5 mg/mL (10.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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: ≥ 3.5 mg/mL (7.17 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.5 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 35.0 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]. Daiichi Sankyo's EZH1/2 Dual Inhibitor Valemetostat (DS-3201) Receives SAKIGAKE Designation for Treatment of Patients with Relapsed/Refractory Peripheral T-Cell Lymphoma from Japan MHLW. [2]. Shimizu J, Kawano F. Exercise-induced histone H3 trimethylation at lysine 27 facilitates the adaptation of skeletal muscle to exercise in mice. J Physiol. 2022 Jul;600(14):3331-3353. [3]. Yamagishi M, et al. Targeting Excessive EZH1 and EZH2 Activities for Abnormal Histone Methylation and Transcription Network in Malignant Lymphomas. Cell Rep. 2019 Nov 19;29(8):2321-2337.e7.

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。 -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	2.0491 mL	10.2455 mL	20.4910 mL	51.2274 mL
	5 mM	0.4098 mL	2.0491 mL	4.0982 mL	10.2455 mL
	10 mM	0.2049 mL	1.0245 mL	2.0491 mL	5.1227 mL
	15 mM	0.1366 mL	0.6830 mL	1.3661 mL	3.4152 mL
	20 mM	0.1025 mL	0.5123 mL	1.0245 mL	2.5614 mL
	25 mM	0.0820 mL	0.4098 mL	0.8196 mL	2.0491 mL
	30 mM	0.0683 mL	0.3415 mL	0.6830 mL	1.7076 mL
	40 mM	0.0512 mL	0.2561 mL	0.5123 mL	1.2807 mL
	50 mM	0.0410 mL	0.2049 mL	0.4098 mL	1.0245 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

	60 mM	0.0342 mL	0.1708 mL	0.3415 mL	0.8538 mL
	80 mM	0.0256 mL	0.1281 mL	0.2561 mL	0.6403 mL
	100 mM	0.0205 mL	0.1025 mL	0.2049 mL	0.5123 mL



源叶