



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **Vorasidenib**
CAS 号: **1644545-52-7**
产品货号: **T19225**

生物活性:				
Description	Vorasidenib (AG-881) is an orally available, brain penetrant second-generation dual mutant isocitrate dehydrogenases 1 and 2 (mIDH1/2) inhibitor. Vorasidenib (AG-881) exhibits nanomolar inhibition of (D)-2-hydroxyglutarate (D-2-HG), and the IC50 ranges of 0.04~22 nM against IDH1 R132C, IDH1 R132G, IDH1 R132H and IDH1 R132S and 7~14 nM against IDH2 R140Q and 130 nM against IDH2 R172K. Vorasidenib can be used for the study of grade 2 astrocytoma or oligodendroglioma with a susceptible IDH1/2 mutation[1][2].			
IC50 & Target	IDH1 IDH2			
In Vitro	Vorasidenib 对人类 U-87 MG pLVX-IDH2 R140Q-neo 胶质母细胞瘤、HT-1080 纤维肉瘤和 TS603 神经球细胞具有强抗增殖活性, IC50 均小于 50 nM[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (241.11 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
		1 mM	2.4111 mL	12.0557 mL
		5 mM	0.4822 mL	2.4111 mL
		10 mM	0.2411 mL	1.2056 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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: 2.5 mg/mL (6.03 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.4 mg/mL (5.79 mM); 悬浊液; 超声助溶 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 (5.02 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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 (5.02 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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 (5.02 mM); 澄清溶液; 加热助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 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]. Fujii T, et al. Targeting isocitrate dehydrogenase (IDH) in cancer. Discov Med. 2016 May;21(117):373-80. [2]. Ma T, et al. Inhibitors of Mutant Isocitrate Dehydrogenases 1 and 2 (mIDH1/2): An Update and Perspective. J Med Chem. 2018 Oct 25;61(20):8981-9003.

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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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	2.4111 mL	12.0557 mL	24.1115 mL	60.2787 mL
	5 mM	0.4822 mL	2.4111 mL	4.8223 mL	12.0557 mL
	10 mM	0.2411 mL	1.2056 mL	2.4111 mL	6.0279 mL
	15 mM	0.1607 mL	0.8037 mL	1.6074 mL	4.0186 mL
	20 mM	0.1206 mL	0.6028 mL	1.2056 mL	3.0139 mL
	25 mM	0.0964 mL	0.4822 mL	0.9645 mL	2.4111 mL
	30 mM	0.0804 mL	0.4019 mL	0.8037 mL	2.0093 mL
	40 mM	0.0603 mL	0.3014 mL	0.6028 mL	1.5070 mL
	50 mM	0.0482 mL	0.2411 mL	0.4822 mL	1.2056 mL
	60 mM	0.0402 mL	0.2009 mL	0.4019 mL	1.0046 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

	80 mM	0.0301 mL	0.1507 mL	0.3014 mL	0.7535 mL
	100 mM	0.0241 mL	0.1206 mL	0.2411 mL	0.6028 mL



源叶