

产品名称: MM-102

产品别名: HMTase Inhibitor IX

生物活性:					
<b>Description</b>	MM-102 是一个高亲和力的多肽模拟的 MLL1 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 0.4 μM。				
<b>IC<sub>50</sub> &amp; Target</b>	MLL1 [1] (Cell-free assay)				
	0.4 μM				
<b>In Vitro</b>	MM-102, 作为 MLL1 的模拟肽, 展现了与 WDR5 的高亲和性, 相应的 IC50 和 Ki 分别为 2.9nM 和 <1nM。在感染了 MLL1-AF9 的鼠源细胞中, MM-102 特异性的降低了两个重要的 MLL1 靶基因 (HoxA9andMeis-1) 的表达, 这两个基因是 MLL1 介导的白血病形成所必须的。另外, MM-102 高效并且选择性的抑制了含有 MLL1 融合蛋白的白血病细胞的生长, 并且诱导了这些细胞的凋亡。[1]				
<b>Solvent&amp;Solubility</b>	<b>In Vitro:</b> DMSO :100 mg/mL (149.30 mM) Water: 100 mg/mL (149.30 mM) Ethanol: 100 mg/mL (149.30 mM)				
	<b>Preparing Stock Solutions</b>	<b>Solvent</b> \ <b>Mass</b> \ <b>Concentration</b>	<b>1 mg</b>	<b>5 mg</b>	<b>10 mg</b>
		1 mM	1.4930 mL	7.4649 mL	14.9298 mL
		5 mM	0.2986 mL	1.4930 mL	2.9860 mL
		10 mM	0.1493 mL	0.7465 mL	1.4930 mL
50 mM	0.0299 mL	0.1493 mL	0.2986 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。					
<b>References</b>	[1] Karatas H, et al. J Am Chem Soc. 2013, 135(2), 669-682.				
实验参考:					
<b>Cell Assay</b>	<b>细胞实验: [1]</b> <b>Cell lines:</b> MV4;11, KOPN8 和 K562 细胞 <b>Concentrations:</b> ~100 μM <b>Incubation Time:</b> 7 天 <b>Method:</b> MV4;11, KOPN8 和 K562 细胞培养在加入 10%胎牛血清以及 100 U/L 青霉素和链霉素的 RPMI 1640 培养基中, 温度 37 °C 5% CO <sub>2</sub> . 密度为 5 × 10 <sup>5</sup> /每孔的 1 mL 细胞种在 12 孔板中, 加入空白对照 DMSO (0.2%) 或者 MM-102 处理七天, 每隔两天更换一次培养基和抑制剂。遵照生产商的说明使用发光法细胞活力检测试剂盒。首先, 在每孔细胞中加入 100 μL 试验试剂, 在回旋振荡器上混和 2 min 来诱导细胞分裂。室温孵育十分钟后, 用酶标仪检测。				
<b>Kinase Assay</b>	<b>体外甲基化转移酶试验: [1]</b> HMT 试验在 50mMHEPESpH7.8, 100mMNaCl, 1.0mMEDTA, 和 5%甘油组成的反应液中进行, 温度为 22°C.每个反应的底物包括 1.5μCi 辅酶, <sup>3</sup> H-S-腺苷甲硫氨酸.H3 十肽, 浓度为 50μM.加入浓度范围在 0.125 到 128μM 的抑制剂以及浓度为 0.5μM 的预组装的 WDR5/RbBP5/ASH2L 复合物孵育 2-5min。然后加入终浓度为 0.5μM 的 MLL1 蛋白开始反应, 30 分钟后用闪烁法测量放射性强度。将				

	反应液滴到方形的 P81 滤纸上，放入到新鲜配制的浓度为 50mM，pH 为 9.0 的重碳酸钠溶液中沉淀，在经过清洗和染色后将样品放入到 UltimaGold 闪烁液中涡旋并计数。该试验利用 0.5 $\mu$ MMLL1/WDR5/RbBP5/ASH2L 与非反应突变 WDR5D107A 的复合物作为负对照。
<b>References</b>	[1] Karatas H, et al. J Am Chem Soc. 2013, 135(2), 669-682.



源叶生物