

产品名称：**MM-102**
产品别名：**HMTase Inhibitor IX**

生物活性:					
Description	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。				
IC50 & Target	MLL1 [1] (Cell-free assay)				
	0.4 μM				
In Vitro	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。在转染了 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]				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO :100 mg/mL (149.30 mM) Water: 100 mg/mL (149.30 mM) Ethanol: 100 mg/mL (149.30 mM)				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		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
<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限 -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。</p>					
References	[1] Karatas H, et al. J Am Chem Soc. 2013, 135(2), 669-682.				
实验参考:					
Cell Assay	<p>细胞实验: [1]</p> <p>Cell lines: MV4;11, KOPN8 和 K562 细胞</p> <p>Concentrations: ~100 μM</p> <p>Incubation Time: 7 天</p> <p>Method:</p> <p>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 °C5% CO2. 密度为 5 × 10⁵/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。</p>				
Kinase Assay	<p>体外甲基化转移酶试验: [1]</p> <p>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，³H-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</p>				

	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 μ MMLL1/WDR5/RbBP5/ASH2L 与非反应突变 WDR5D107A 的复合物作为负对照。
References	[1] Karatas H, et al. J Am Chem Soc. 2013, 135(2), 669-682.



源叶生物