

## MLN9708

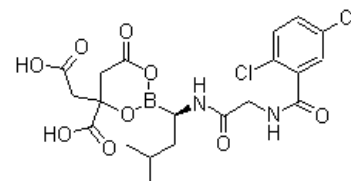
产品编号：MB3702

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：粉状

### 基本信息

分子式	C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> BCl <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>9</sub>	结 构 式	
分子量	517.12		
CAS No.	1201902-80-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (193.37 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介：**MLN2238 抑制 20S proteasome 的胰凝乳蛋白酶等蛋白水解位点。

**别名：**MLN 9708; MLN-9708;Ixazomib; MLN 9708; MLN-9708;4-Carboxy-2-[(1R)-1-[[2-[(2,5-dichlorobenzoyl)amino]acetyl]amino]-3-methylbutyl]-6-oxo-1,3,2-dioxaborinane-4-acetic acid

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (193.37 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	MLN9708 在水溶液或血浆中立即水解为 MLN2238，MLN2238 是具有生物活性的形式，MLN2238 抑制 20S proteasome 的胰凝乳蛋白酶等蛋白水解位点（β5），IC <sub>50</sub> /K <sub>i</sub> 为 3.4 nM/0.93 nM,对 β1 作用效果稍弱，对 β2 几乎没有抑制活性。			
<b>靶点</b>	20S 蛋白酶体的糜蛋白酶类水解(β5)位点	20S 蛋白酶体的糜蛋白酶类水解 (β5)位点	20S 蛋白酶体的 caspase 类水解(β1)位点	20S 蛋白酶体的胰蛋白酶类水解 (β2)位点

<b>IC50</b>	3.4 nM	0.93 nM(Ki)	31 nM	3.5 μM
<b>体外研究</b>	与 bortezomib 相比, MLN9708 分离半衰期更短, 药物动力学, 药效, 及抗癌活性更高。MLN9708 是二代小分子蛋白酶体抑制剂, 用于治疗多种人类恶性胶质瘤。和水溶液和血浆接触后, MLN9708 快速水解为 MLN2238。MLN2238 是 MLN9708 的生物活性形式。MLN2238 是氮端加帽的二肽亮氨酸硼酸, 抑制 20S 蛋白酶体的糜蛋白酶类(β5)水解位点, IC50 为 3.4 nM, Ki 值为 0.93 nM。更高浓度时, MLN2238 也抑制 20S 蛋白酶体的 caspase 类水解(β1)位点和胰蛋白酶类水解(β2)位点, IC50 分别为 31 nM 和 3.5 μM。MLN2238 是蛋白酶体的有效选择性可逆抑制剂, 这种可逆性存在时间依赖性。			
<b>体内研究</b>	MLN9708 作用于实体瘤和血液方面的临床前期移植瘤时具有极高的抗癌活性。最新临床前期药理学研究显示 MLN9708 作用于移植瘤, 具有更短的分半衰期, 更高的药物动力学, 药效, 及抗癌活性。MLN9708 作用于多种移植瘤具有抗癌活性。			
<b>特征</b>	在早期多发性骨髓瘤的临床实验阶段, MLN9708 是第一个口服的蛋白酶体抑制剂。			

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB5137	MG132,蛋白酶体抑制剂
MB2634	PSI(蛋白酶体抑制剂);Proteasome Inhibitor 1
MB4176	MG-132-(R)

**用途及描述:** 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。当暴露于水溶液或血浆中时, MLN9708 立即水解为具有生物活性形式的 MLN2238。MLN2238 抑制 20S 蛋白酶体的胰凝乳蛋白酶样蛋白水解位点。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9338 mL	9.6689 mL	19.3379 mL
5 mM	0.3868 mL	1.9338 mL	3.8676 mL
10 mM	0.1934 mL	0.9669 mL	1.9338 mL
50 mM	0.0387 mL	0.1934 mL	0.3868 mL

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

## 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会严重影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表  
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体

产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。