

MLN-2238 ; Ixazomib ; Ixazomib ; MLN2238

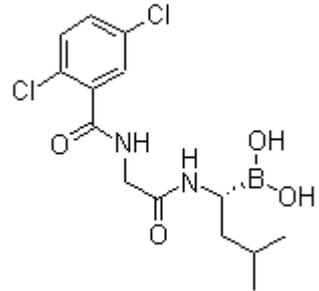
产品编号 : MB3703

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;50MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C14H19BCl2N2O4	结构式	
分子量	361.03		
CAS No.	1072833-77-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 72 mg/mL (199.42 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 9 mg/mL (24.92 mM)		
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: 艾沙佐米 MLN2238 是一种有效的选择性的可逆蛋白酶体 (proteasome) 抑制剂, 抑制 20S 蛋白酶体的糜蛋白酶样蛋白水解 ($\beta 5$) 位点, IC_{50} 为 3.4 nM, K_i 为 0.93 nM。

别名: Ixazomib;MLN 2238;MLN-2238 ; B-[(1R)-1-[[2-[(2,5-dichlorobenzoyl)amino]acetyl]amino]-3-methylbutyl]boronic acid

物理性状及指标:

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 72 mg/mL (199.42 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 9 mg/mL (24.92 mM)

含量 :>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Ixazomib;MLN2238 抑制 20S proteasome 的糜蛋白酶样蛋白水解位点($\beta 5$), IC_{50} 和 K_i 分别为 3.4 nM 和 0.93 nM, 也抑制 caspase 样 ($\beta 1$) 和胰蛋白酶样($\beta 2$) 蛋白水解位点, IC_{50} 分别为 31 和 3500 nM。	
靶点	20S proteasome	20S proteasome

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
IC50	0.93 nM(Ki)	3.4 nM
体外研究	Ixazomib;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(β 5) 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 (β 1)位点和胰蛋白酶类水解(β 2)位点，IC50 分别为 31 nM 和 3.5 μ M。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。MLN2238 抑制 Calu-6 细胞，IC50 为 9.7 nM。MLN2238 作用于肿瘤细胞，为蛋白酶体的有效选择性可逆抑制剂。MLN2238 和 Bortezomib 都为蛋白酶体的可逆抑制剂，都存在时间依赖性，但是 MLN2238 作用于蛋白酶体的分离半衰期比 Bortezomib 作用快 6 倍 (分别为 18 和 110 分钟)。MLN2238 从蛋白酶体中分离比 Bortezomib 快，与 Proteasome-Glo 实验中蛋白酶体活性更快恢复一致。MLN2238 比 Bortezomib 具有更高的肿瘤药效。MLN2238 是 MLN9708 的生物活性形式。	
体内研究	Ixazomib;MLN2238 作用于移植瘤时，比 bortezomib 产生更强的药效反应。与 bortezomib 相比，作用于移植瘤时，MLN2238 显示更高的最大值和持久的抑制肿瘤蛋白酶效果。说明用 MLN2238 处理的肿瘤，药效反应得到明显提高。MLN2238 作用于 CWR22 移植瘤显示抗癌活性。与 bortezomib 相比，作用于 WSU-DLCL2 移植瘤模型，MLN2238 显示更强的肿瘤药效反应。另外，作用于 OCI-Ly10 和 PHTX22L 模型，MLN2238 比 bortezomib 具有更高的药效和抗癌活性。	
特征	Ixazomib;MLN2238 是一流的蛋白酶抑制剂，在临床前期研究中，提高药物动力学活性，药效，及抗癌活性。	

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)

MB3702	MLN9708
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。MLN2238 抑制了 chymotrypsin-like 蛋白水解(β 5)的 20 s 蛋白酶体 IC50 与 Ki 3.4 和 0.93 nM,分别也抑制了 caspase-like(β 1)和 trypsin-like(β 2)蛋白水解网站,IC50 31 和 3500 海里。MLN2238 是肿瘤细胞中蛋白酶体的选择性、强效、可逆抑制剂。MLN2238 具有时间依赖性可逆蛋白酶体抑制作用。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	2.7699 mL	13.8493 mL	27.6985 mL
5 mM	0.5540 mL	2.7699 mL	5.5397 mL
10 mM	0.2770 mL	1.3849 mL	2.7699 mL
50 mM	0.0554 mL	0.2770 mL	0.5540 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	激酶实验: Calu-6 细胞培养在含 10%FBS 和 1%青霉素/链霉素的 MEM 培养基中, 1 天后, 按每孔 1×10^4 个细胞加到 384 孔板上。加入荧光酶素和 Proteasome-Glo 检测试剂, 观察糜蛋白酶类底物 Suc-LLVY-aminoluciferin 的水解, 测定蛋白酶体活性。使用 LEADseeker 设备测定荧光值。
细胞实验 :	Cell lines: Calu-6 细胞 Concentrations: 10nM 左右 Incubation Time: 1 小时或 30 分钟 Method: Calu-6 细胞培养在含 10%FBS 和 1%青霉素/链霉素的 MEM 培养基中, 1 天后, 按每孔 1×10^4 个细胞加到 384 孔板上。为了测定 IC50 值, 用溶于 DMSO (0.5%, v/v) 的不同浓度 bortezomib 或 MLN2238 在 37°C 下处理细胞 1 小时。用于可逆性实验, 用 $1 \mu\text{mol/L}$ bortezomib 或 MLN2238 在 37°C 下处理细胞 30 分钟, 然后在培养基中洗三次洗去 bortezomib 或 MLN2238。细胞在 37°C 下再温育 4 小时, 然后移除培养基换上新的培养基。
动物实验 :	Animal Models: 皮下注射 5.0×10^6 个 MM.1S 细胞的 CB-17 SCID 鼠 Formulation: 溶于 5% 2-羟丙基- β -环糊精 Dosages: 11 mg/kg Administration: 静脉注射, 每周两次, 持续三周

【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，否则会影影响化合物活性，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。