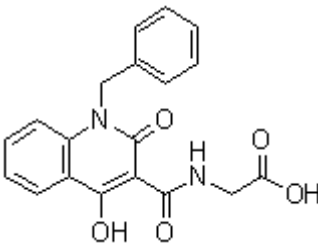


Oprozomib; ONX 0912

产品编号: MB3714
质量标准: >98%,BR
包装规格: 5MG;10MG
产品形式: solid

基本信息

分子式	C25H32N4O7S	结 构 式	
分子量	532.61		
CAS No.	935888-69-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 100 mg/mL (187.75 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: Oprozomib (ONX 0912; PR047)是口服生物相容性的抑制剂, 能抑制 20S proteasome (20S 蛋白酶体) β5/LMP7 的 CT-L 活性, IC50 为 36 nM/82 nM。

别名: ONX-0912; ONX0912; PR-047; PR047; ONX-0912; ONX0912; PR-047; PR047

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 100 mg/mL (187.75 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

产品描述	Oprozomib(ONX 0912)是口服生物有效的抑制剂, 抑制 20S proteasomeβ5/LMP7 的 CT-L 活性, IC50 为 36 nM/82 nM。	
靶点	20S proteasome β5	20S proteasome LMP7
IC50	36 nM	82 nM
体外研究	Oprozomib 的抗 MM 活性与 caspase-8, caspase-9, caspase-3,和 PARP 的激活, 及 MM 细胞的迁移和血管生成受抑制相关。	
体内研究	Oprozomib 处理啮齿类动物和狗, 表现出的绝对生物利用度高达 39%。Oprozomib 按剂量重复口服处理大多数组织具有良好的耐受性, 抑制>80%蛋白酶, 处理多种人类肿瘤移植瘤和小鼠同系模型, 诱导抗肿瘤反应。	

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。Oprozomib (ONX 0912; PR047)是口服生物相容性的抑制剂，能抑制 20S proteasome (20S 蛋白酶体) β 5/LMP7 的 CT-L 活性，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	1.8775 mL	9.3877 mL	18.7755 mL
5 mM	0.3755 mL	1.8775 mL	3.7551 mL
10 mM	0.1878 mL	0.9388 mL	1.8775 mL
50 mM	0.0376 mL	0.1878 mL	0.3755 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>ELISA 活性部位结合实验:</p> <p>在室温下使用生物素化的活性位点探针 PR-584 (5-15μM) 处理样品 (裂解的细胞或组织匀浆) 1 小时。加入 SDS (终浓度为 0.9%)使样品变性，在 100$^{\circ}$C 下加热 5 分钟。变性的样品转移到 96 孔或 384 孔过滤板上，与链霉亲和素琼脂糖珠(每孔 2.5-5 μL 珠) 混合,在室温下在摇床上温育 1 小时。每孔使用 100-200 μL ELISA buffer (PBS,1% 牛血清白蛋白,0.1% Tween-20)通过真空过滤冲洗珠 5 次。珠与抗体在摇床上 4$^{\circ}$C 温育过夜。每孔使用 100-200 μL ELISA buffer 冲洗珠 5 次，然后与在 ELISA buffer 中按 1:5000 稀释的 HRP 标记的二抗在摇床上在室温下温育 2 小时。每孔使用 100-200 μL ELISA buffer 冲洗珠 5 次，测定化学发光信号。使用酶标仪测定发光值。读板器上测量发光值，并转换成 ng 蛋白酶体或 μg/ml 细胞裂解液，通过对照 20S 蛋白酶体或未处理的细胞裂解液的标准曲线。蛋白酶体抑制剂的研究中，活性位点探针结合值表示为与 DMSO 处理的细胞结合的相对百分数。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: MM.1S, MM.1R, RPMI-8226, KMS12, INA-6, OPM-2, Dox-40</p> <p>Concentrations: ~1 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: MTT 实验</p>
动物实验:	<p>Animal Models: 携带非 Hodgkin 淋巴瘤细胞系的 RL 移植瘤，肠肿瘤细胞系 CT-26 移植瘤的鼠</p> <p>Formulation: 10% (v/v) EtOH 和 10% (v/v) PS80 溶于柠檬酸盐缓冲液(pH 3.5)</p> <p>Dosages: 30 mg/kg, 每周两次</p> <p>Administration: 口服处理</p>

【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。