

MLN0905

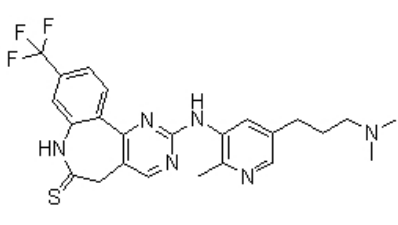
产品编号：MB4017

质量标准：>98%，有效的 PLK1 抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C24H25F3N6S	结 构 式	
分子量	486.56		
CAS No.	1228960-69-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：97 mg/mL (199.35 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：MLN0905 是一种有效的 PLK1 抑制剂。

别名：PLK1 Inhibitor；6H-Pyrimido[5,4-d][1]benzazepine-6-thione,

2-[[5-[3-(dimethylamino)propyl]-2-methyl-3-pyridinyl]amino]-5,7-dihydro-9-(trifluoromethyl)-

物理性状及指标：

外观：.....黄色至粉色固体

溶解性：.....DMSO：97 mg/mL (199.35 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	MLN0905 是一种有效的 PLK1 抑制剂，IC50 为 2 nM。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>PLK1</td> </tr> <tr> <td>2 nM</td> </tr> </table>	PLK1	2 nM
PLK1			
2 nM			
体外研究	MLN0905 是有效的 PLK1 抑制剂，IC50 为 2 nM。MLN0905 抑制细胞有丝分裂，EC50 为 9 nM。MLN0905 抑制 Cdc25C-T96 磷酸化，直接抑制 PLK1，EC50 为 29 nM。MLN0905 抑制 HT-29 生活力，LD50 为 22 nM。MLN0905 选择性作用于一组 359 种激酶。MLN0905 抑制一组淋巴瘤细胞活力，IC50 为 3-24 nM。		
体内研究	MLN0905 按 6.25 mg/Kg-50 mg/Kg 剂量口服处理携带 HT-29 移植瘤的裸鼠，处理 48 小时后，显示药效学反应，这种作用具有剂量依赖性。MLN0905 按 3.12 mg/Kg-6.25 mg/Kg 剂量口服处理携带 OCI LY-19-Luc 肿瘤的小鼠，具有显著的药效学反应，处理 8 小时后达到峰值。MLN0905 处理携带 LY-19-Luc 移植瘤的 SCID 小鼠 21 天，具有抗肿瘤的效果。每天按 6.25 mg/Kg 剂量处理的实验组的 T/C 值为 0.15。		

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)

MB3355	BI 2536
MB4016	Rigosertib (ON-01910)
MB4015	Volasertib (BI 6727)

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。MLN0905 是一种有效的 PLK1 抑制剂。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	2.0552 mL	10.2762 mL	20.5524 mL
5 mM	0.4110 mL	2.0552 mL	4.1105 mL
10 mM	0.2055 mL	1.0276 mL	2.0552 mL
50 mM	0.0411 mL	0.2055 mL	0.4110 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	PLK1 Flash Plate 检测: 人类 PLK1 酶促反应共计 30 μ L，包含 50 mM Tris-HCl (pH 8.0), 10 mM MgCl ₂ , 0.02% BSA, 10%甘油, 1 mM DTT, 100 mM NaCl, 3.3% DMSO, 8 μ M ATP, 0.2 μ Ci[γ - 33P]-ATP, 4 μ M 肽底物 (生物素-AHX-LDETGHLDSSGLQEVHLA-CONH ₂), 及 10 nM 重组人类 PLK1[2-369]T210D。在有或无 PLK 抑制剂存在时，酶促反应混合物在 30 $^{\circ}$ C 下温育 2.5 小时，然后使用 20 μ L 150 mM EDTA 终止。然后 25 μ L 终止的酶反应混合物转移到 384 孔链霉亲和素覆盖的 Image FlashPlate 上，在室温下温育 3 小时。使用 0.02% Tween-20 洗涤 Image Flash Plate 孔三次，然后在 Perkin-Elmer Viewlux 上读数。
--------------	--

【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。