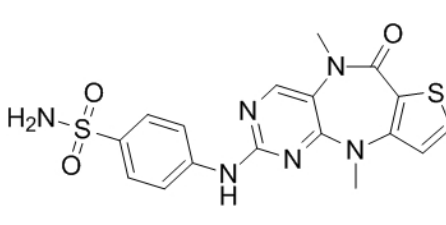


XMU-MP-1

产品编号：MB4175
质量标准：>98%,BR
包装规格：5MG;25MG
产品形式：solid

基本信息

分子式	C17H16N6O3S2	结 构 式	
分子量	416.48		
CAS No.	2061980-01-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 83 mg/mL (199.28 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 1 mg/mL (2.4 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：XMU-MP-1 是可逆和选择性的 MST1/2 抑制剂。

别名：Benzenesulfonamide, 4-[(6,10-dihydro-5,10-dimethyl-6-oxo-5H-pyrimido[5,4-b]thieno[3,2-e][1,4]diazepin-2-yl)amino]-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 83 mg/mL (199.28 mM);Water : Insoluble;Ethanol : 1 mg/mL (2.4 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	XMU-MP-1 是 MST1/2 的抑制剂，抑制 MST1 和 MST2 的 IC50 分别为 71.1±12.9 nM 和 38.1±6.9 nM。	
靶点	MST2 38.1 nM	MST1 71.1 nM
体外研究	XMU-MP-1 抑制 MST1/2 活性，因此能够激活下游效应分子 Yap 蛋白及促进细胞生长。XMU-MP-1 能以剂量依赖方式抑制 MOB1 的磷酸化。此外，随着 ATP 浓度的升高，XMU-MP-1 对 MST1/2 的 IC50 值呈比例增加，对 MST2 介导的 MOB1 磷酸化的抑制减少。当浓度为 0.1-10 μM 时，XMU-MP-1 能以剂量依赖方式减少 HepG2 细胞中内源性 MOB1, LATS1/2, YAP 的磷酸化。同样地，XMU-MP-1 的处理在多种细胞系（包括小鼠巨噬样细胞 RAW264.7, 人类骨肉瘤细胞 U2OS, 人结肠癌细胞 SW480, 永生化人类视网膜色素上皮细胞 RPE1, 人类多形性肝细胞癌细胞 SNU-423, HepG2 以及小鼠原代肝细胞）中能够抑制 H202 引起的 MOB1 和 MST1/2 磷酸化，而不影响 JNK 的磷酸化。XMU-MP-1 的处理能增加 YAP 的核定位。	
体内研究	腹腔注射 1-3 mg/kg 的 XMU-MP-1 到急性/慢性肝损伤的小鼠模型中，XMU-MP-1 在体内具有	

良好的药代动力学，能够提高小鼠肠道、肝脏修复和再生。在大鼠中，其药代动力学也十分有利，半衰期为 1.2 小时，生物利用度为 39.5%。在腹腔注射 1 mg/kg 的 XMU-MP-1 后 1.5-6 小时，MOB1 和 YAP 磷酸化达到最高水平。XMU-MP-1 能够保护小鼠免受 DSS 诱导的结肠炎及减轻慢性肝损伤。

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。XMU-MP-1 是可逆和选择性的 MST1/2 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
1 mM	2.4011 mL	12.0054 mL	24.0108 mL
5 mM	0.4802 mL	2.4011 mL	4.8022 mL
10 mM	0.2401 mL	1.2005 mL	2.4011 mL
50 mM	0.0480 mL	0.2401 mL	0.4802 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	<p>Cell lines: HepG2</p> <p>Concentrations: 1 μM 或 3 μM</p> <p>Incubation Time: 6 h</p> <p>Method: 用 XMUMP-1 处理 HepG2 细胞 6 小时，提取细胞 RNA 进行 RT-qPCR，分析 CTGF 和 CYR61 的表达水平。</p>
动物实验	<p>Animal Models: FRG 小鼠</p> <p>Formulation: 20% Solutal</p> <p>Dosages: 1 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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。