

PI-1840

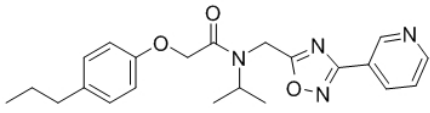
产品编号：MB4178

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₂ H ₂₆ N ₄ O ₃	结 构 式	
分子量	394.47		
CAS No.	1401223-22-0		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO : 78 mg/mL (197.73 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 33 mg/mL (83.65 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：PI-1840 是蛋白酶体 chymotrypsin-like (CT-L) 高效选择性抑制剂。

别名：Acetamide,

N-(1-methylethyl)-2-(4-propylphenoxy)-N-[[3-(3-pyridinyl)-1,2,4-oxadiazol-5-yl]methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 78 mg/mL (197.73 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 33 mg/mL (83.65 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PI-1840 是一种可逆的选择性的 chymotrypsin-like (CT-L) 抑制剂，IC ₅₀ 为 27 nM，对其他两个主要的蛋白酶体 (trypsin-like (T-L) 和 postglutamyl-peptide-hydrolysis-like (PGPH-L)) 蛋白水解活动没有作用。
靶点	Chymotrypsin-like proteasome 27 nM
体外研究	PI-1840 有效抑制完整人 MDA-MB-468 癌细胞中蛋白酶体 CT-L 的活性，并抑制人 MDA-MB-468 细胞的增殖/存活。在完整的癌细胞中，PI-1840 抑制 CT-L 活性，诱导蛋白酶体底物 p27, Bax, 和 IκB-α 积累，抑制存活途径和生存能力，并诱导细胞凋亡。
体内研究	PI-1840 (150 毫克/千克，腹腔注射) 抑制负荷 MDA-MB-231 乳腺肿瘤小鼠体内的肿瘤生长。

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。PI-1840 是蛋白酶体 chymotrypsin-like (CT-L) 高效选择性抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5350 mL	12.6752 mL	25.3505 mL
5 mM	0.5070 mL	2.5350 mL	5.0701 mL
10 mM	0.2535 mL	1.2675 mL	2.5350 mL
50 mM	0.0507 mL	0.2535 mL	0.5070 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>CT-L, T-L, PGPH-L 蛋白水解活性测定:</p> <p>在高通量筛选中, 荧光肽(10 μM)用作底物以测定 ChemBridge 中 50,000 个化合物对纯化的兔子 20S 蛋白酶体中 CT-L 蛋白质分解的抑制活性。为测试对 CT-L 的选择性高于 T-L 和 PGPH-L, 使用相应的荧光肽。简而言之, 1 nM 纯化的 20S 兔子蛋白酶体分别与 20 μM Suc-Leu-Leu-Val-Tyr-AMC (用于 CT-L 活性测定), Bz-Val-Gly-Arg-AMC (用于 T-L 活性测定), 苄氧羰基 Z-Leu-Leu-Glu-AMC (用于 PGPH-L 活性测定) 在 100 微升包含或不包含化合物的测试缓冲液(50 mM Tris-HCl, pH 7.6)中于 37°C 下培养 1 小时。培养后, 水解的产物 7-酰胺基-4-甲基-香豆素(AMC)基团使用 WALLAC Victor2 1420 多标记分析仪在激发滤光 355nm 发射滤光 460nm 下测量。释放的 AMC 的量呈线性。使用 Bortezomib 作为阳性对照, 用于 IC50 测定。为测定全细胞中蛋白酶体的活性, 用培养细胞裂解物中的提取物(5 微克)代替 20S 兔子蛋白酶体, 按照上述相同的方法进行测定。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: MDA-MB-468 细胞</p> <p>Concentrations: ~200 μM</p> <p>Incubation Time: 5 天</p> <p>Method: 细胞接种在含 100 微升培养基的 96 孔板中, 并附着过夜。然后细胞在不同浓度的抑制剂存在下培养 120 小时。抽出培养基, 用 100 微升包含 1 毫克/毫升 MTT 的完全培养基替代, 并于 37°C 下在含 5% CO₂ 潮湿的培养箱中培养 3 小时。然后抽出培养基, 加入 DMSO。细胞在室温下摇动培养 10 分钟, 吸光度在 540 nm 下使用 μQuant 分光光度酶标仪测定。IC50 值使用方程式在 CT-L, T-L, PGPH-L 蛋白水解活性试验中测定。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 人乳腺癌 MDA-MB-231 异种移植的裸鼠</p> <p>Formulation: 30% 2-羟丙基-β-环糊精</p> <p>Dosages: ~150 毫克/千克, 每天</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。