

MG-132 ; MG132 ; 蛋白酶体抑制剂

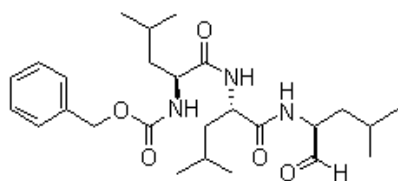
产品编号 : MB5137

质量标准 : >98% , proteasome 抑制剂

包装规格 : 5MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C26H41N3O5	结 构 式	
分子量	475.62		
CAS No.	133407-82-6		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 90 mg/mL (189.22 mM) Water Insoluble Ethanol : 25 mg/mL (52.56 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 : MG-132 是一种有效, 可逆, 能渗透细胞的 20S 蛋白酶体 抑制剂。它抑制蛋白酶体胰凝乳蛋白酶样肽酶活性。

别名 : L-Leucinamide, N-[(phenylmethoxy)carbonyl]-L-leucyl-N-[(1S)-1-formyl-3-methylbutyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 90 mg/mL (189.22 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 25 mg/mL (52.56 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	MG-132 是一种具有细胞透性的蛋白酶体和 calpain 抑制剂, IC50 分别为 100 nM 和 1.2 μM。
靶点	20S proteasome (Cell-free assay)

	100 nM
体外研究	<p>MG-132 抑制 20S 蛋白酶体 ZLLL-MCA 降解活性, IC50 为 100 nM, 比 ZLLal(IC50 为 110 μM)有效 1000 多倍。MG-132 也会抑制钙蛋白酶, IC50 为 1.2 μM。MG-132 在 20 nM 的最佳浓度下诱导 PC12 细胞中神经突增生, 表现出高于 ZLLal 500 倍的效能。MG-132 (10 μM) 通过抑制蛋白酶体介导的 IκBα 降解, 有效抑制 A549 细胞中 TNF-α 诱导的 NF-κB 活化, 白介素-8 (IL-8) 基因转录, 和 IL-8 蛋白质释放。MG-132 处理通过抑制 26S 蛋白酶体, 有效诱导 p53 依赖性 KIM-2 细胞凋亡。不同于 BzLLCOCHO 或 PS-341, MG-132 处理对 26S 蛋白酶体的糜蛋白样(CT-L)和肽谷氨酰基肽水解(PGPH)活性抑制较弱, 而相对于 BzLLCOCHO, MG-132 能够更有效诱导多发性骨髓瘤细胞(U266 和 OPM-2)的细胞凋亡。MG-132 (1 μM) 通过激活 AP-1 家族成员 c-Fos 和 c-Jun, 使 TRAIL 抗性前列腺癌细胞敏感, 这反过来抑制抗凋亡分子 c-FLIP(L)。MG-132 显著增强肌醇六磷酸(IP6)的作用以降低 PC3 和 DU145 雄激素非依赖性前列腺癌(AIPCa)细胞系的细胞代谢活性。</p>
体内研究	<p>MG-132 给药有效恢复 mdx 小鼠骨骼肌纤维中肌萎缩蛋白, β-营养不良聚糖蛋白, α-营养不良聚糖蛋白, 和 α-肌聚糖蛋白的表达水平和血浆膜定位, 减少肌肉膜损伤, 并改善肌肉萎缩症的组织病理学信号。MG-132 治疗通过下调肌肉特异性泛素连接酶 atrogin-1/MAFbx 和 MuRF-1 mRNA, 显著减少小鼠体内固定化诱导的骨骼肌萎缩。</p>

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)

MB2634	PSI(蛋白酶体抑制剂);Proteasome Inhibitor 1
MB6152	PD 151746

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。MG-132 是一种具有细胞透性的蛋白酶体和 calpain 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	2.1025 mL	10.5126 mL	21.0252 mL
5 mM	0.4205 mL	2.1025 mL	4.2050 mL
10 mM	0.2103 mL	1.0513 mL	2.1025 mL
50 mM	0.0421 mL	0.2103 mL	0.4205 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>MG-132 对 20S 蛋白酶体抑制活性的测定: 20S 蛋白酶体抑制试验的反应混合物包含 0.1 M Tris-乙酸, pH 7.0, 20S 蛋白酶体, MG-132, 和 25 μM 底物, 溶解于二甲亚砜, 终体积为 1 mL。在 37 °C 下培养 15 分钟后, 加入</p>
-------------	---

	pH 9.0 的 0.1 mL 10% SDS 和 0.9 mL 0.1M Tris 乙酸盐停止反应。测量反应产物的荧光。为测定对 20S 蛋白酶体的 IC50，试验混合物中包含不同浓度的 MG-132。
细胞实验	<p>Cell lines: KIM-2, HC11, 和 ES</p> <p>Concentrations: 溶解于 DMSO, 终浓度为~25 μM</p> <p>Incubation Time: 24 和 48 小时</p> <p>Method: 细胞在不同浓度的 MG-132 下暴露 24, 和 48 小时。上清液和单层细胞通过离心采集, 并固定在含 70%乙醇的 PBS 中, 用吖啶橙着色。等体积细胞和吖啶橙(5 mg/mL 的 PBS 溶液)在显微镜载玻片上固定, 并通过荧光显微镜检测。对于膜联蛋白 V 分析, 细胞通过离心采集, 并用膜联蛋白 V 和碘化丙啶着色。对于细胞分析, 细胞在 PBS 中于室温下再水化 10 分钟, 随后用碘化丙啶(5 mg/mL)着色。所有样品使用 Coulter Epics XL 流式细胞分析仪分析。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 雄性 mdx (C57BL/10ScSn DMD mdx) 小鼠</p> <p>Formulation: 在 DMSO 中溶解, 并在 PBS 中稀释</p> <p>Dosages: ~10 μg/kg/day</p> <p>Administration: 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, 否则会严重影响化合物活性, 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。