

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	M10007
产品名称:	蛋白酶体抑制剂

产品简介:

一种强效的蛋白酶体和钙蛋白酶 (calpain) 抑制剂, IC₅₀ 分别为 100 nM 和 1.2 μM。MG-132 可有效阻断 26S 蛋白酶体复合物的蛋白水解活性。MG-132 是一种肽醛, 是自噬 激活剂。MG-132 还诱导凋亡。

靶点: IC₅₀: 100 nM (Proteasome), 1.2 μM (Calpain)

体外研究:

MG-132 (Z-Leu-Leu-Leu-al) 在低浓度 (30 nM) 下启动 PC12 细胞的神经突生长, 是一种非常强的 20S 蛋白酶体抑制剂。

MG-132 (10 μM; 1 小时) 可逆转 A549 细胞中 TNF-α 对 IκB 降解和 NF-κB 活化的影响。

MG-132 (0.75-5 μM; 24 小时) 通过 26S 蛋白酶体抑制作用在 KIM-2 细胞中有效诱导 p53 依赖性细胞凋亡。

MG-132 (10-40 μM; 24 小时) 以时间依赖性和浓度依赖性方式显著降低 C6 神经胶质瘤细胞的活力, 并显示 IC₅₀ 在 24 小时时为 18.5 μM。

MG-132 (18.5 μM; 24 小时) 诱导抗凋亡蛋白 Bcl-2 和 XIAP 的下调, 并上调促凋亡蛋白 Bax 和 caspase-3 的表达。

体内研究:

MG-132 (10 mg/kg; 腹腔注射; 从注射 EC9706 细胞后 5 天开始每天施用 25 天) 显著抑制 EC9706 异种移植物的肿瘤生长, 而不会对小鼠造成毒性。

MG-132 (1 mg/kg; 静脉注射; 每周两次, 持续 4 周) 对携带 HeLa 肿瘤的小鼠显示出有效的肿瘤抑制作用。

MG-132 (1-10 μg/kg/day; 皮下植入渗透泵; 持续 8 天) 显著增加小鼠骨骼肌裂解液中 β-肌营养不良聚糖、α-肌营养不良聚糖、α-肌肌聚糖和抗肌萎缩蛋白的表达水平 (6 月龄雄性 C57BL/10ScSn DMD mdx 小鼠)。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
溶于 DMSO (≥90mg/mL)、水 (<1.2mg/mL) 和乙醇 (≥90mg/mL)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
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
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month.			
二: 体内实验			



1、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: ≥ 1.67 mg/mL (3.51 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。

2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: 1.67 mg/mL (3.51 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 1.67 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。

2 g SBE- β -CD (磺丁基醚 β -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 1.67 mg/mL (3.51 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

注: 工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20℃

