

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	H10028
产品名称:	HMN-214

产品简介:

HMN-214 是 HMN-176 的前体药物, 是一种有效的、广泛的肿瘤特异性试剂。

HMN-214 (IVX-214) is a potent inhibitor of Polo-like kinase (Plk) with IC₅₀ of 118 nM. HMN-214 shows potent and broad-spectrum anti-tumor activity against various cancer cells, including HeLa, PC-3, DU-145, MIAPaCa-2, U937, MCF-7, A549, and WiDr, with a mean IC₅₀ value of 118 nM. HMN-176 is also cytotoxic to drug-resistant human and murine cell lines, including P388/CDDP, P388/VCR, K2/CDDP, and K2/VP-16, with IC₅₀ values ranging from 143 nM - 265 nM. In HeLa cells, HMN-176 (3 μM) blocks cell cycle at G2/M phase. HMN-176 (3 μM) down-regulates the expression of the multi-drug resistance gene (MDR1), due to the disturbance of NF-Y transcription factor binding to the MDR1 promoter. HMN-176 (250 nM - 2.5 μM) inhibits meiotic spindle assembly and aster formation of Spisula oocytes. HMN-176 (2.5 μM) also inhibits aster microtubule formation from human centrosomes.

靶点: PLK1

体外研究:

HMN-214 是 HMN-176 的前药。HMN-176 显示出对 22 种人类肿瘤细胞系的有效活性, 平均 IC₅₀ 为 118 nM。

HMN-176 (3-300 nM) 在 HeLa 细胞中以剂量依赖性方式抑制由 MDR1 启动子驱动的荧光素酶表达。HMN-176 (30-3000 nM) 还可以剂量依赖性地抑制 Y 盒上的复合物形成。

HMN-214 (3.3 μM) 相较于载体对照, 增强了 PC3-PSMA 细胞中荧光素酶的表达, 使用 1, 4C-1, 4Bis 聚合物转染时增加了 11 倍, 使用 PEI 转染时增加了 37 倍。HMN-214 (≥ 3.3 μM) 显著抑制了 MB49 细胞的增殖, 并在细胞形态上造成了显著变化。

体内研究:

HMN-214 (33 mg/kg, po) 在大鼠体内转化为 HMN-176。HMN-214 对坐骨神经和胫神经的传导速度和动作电位幅度没有影响。HMN-214 (20 mg/kg, po) 在小鼠体内表现出抗肿瘤活性。HMN-214 (10、20 mg/kg, 口服) 降低携带 KB 和 KB-A. 1. 衍生肿瘤的裸鼠的 MDR1 mRNA 表达。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (12 mg/mL)

浓度	质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM		2.3559 mL	11.7794 mL	23.5588 mL
5 mM		0.4712 mL	2.3559 mL	4.7118 mL
10 mM		0.2356 mL	1.1779 mL	2.3559 mL

储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。

二: 体内实验

真实 准确 稳定 负责

010-60605840
www.jm-bio.com
psaitong@jm-bio.com

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

Solubility: ≥ 0.62 mg/mL (1.46 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 0.62 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 6.2 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: ≥ 0.62 mg/mL (1.46 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 0.62 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 6.2 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: ≥ 0.62 mg/mL (1.46 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 0.62 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 6.2 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。

三、激酶实验

体内 Spisula 卵母细胞纺锤体的装配:

为了用延时视频显微镜观察, 10% v/v Spisulao 卵母细胞悬浮液在过滤的海水中制备。加入溶于 DMSO 的 HMN-214, 终浓度为 0.25 μ M, 在室温下温育 10 分钟, 使用 70 mM KCl 激活卵母细胞。加入 HMN-214 或 HMN-176 或 DMSO 制备适当浓度 KCl 储液, 在终悬液中维持适当浓度。Oocyte 卵母细胞悬液在载玻片上制备, 使用 Zeiss Axiophot 偏振光显微镜, 配备 20X/0.50 NA 物镜和 Hamamatsu SIT-摄像机及联合 Metamorph 图像处理软件进行检测。用于免疫荧光 (IMF) 研究, 在不同时间点 (0, 4, 8, 16, 25, 35, 和 45 分钟), 转移卵母细胞悬液等分到固定液 (0.6% Brij-58, 4% 甲醛, 100 mM PIPES, 5 mM EGTA, 1 mM MgCl₂, 用 NaOH 调 pH 为 6.8) 中, 维持 15 分钟, 在 PBS 中冲洗, 然后在 PBS 中用 3% 牛血清蛋白进行“封锁”。为了观察微管, 用原代大鼠 α -tubulin 抗体标记卵母细胞, 在 PBS 中清洗, 然后用抗鼠抗体联合的 Alexa Fluor 488 的二抗进行标记。在最后洗涤步骤之一中加入 1 μ g/mL Hoechst 33342, 用于观察染色体。用 Zeiss AxioImager Z1 系统, 配备 40X/1.3 NA 物镜, 联合 Axiovision 软件观察卵母细胞。

四、细胞实验

细胞系: HeLa, PC-3, DU-145, MIA PaCa-2, U937, MCF-7, A549, 和 WiDr 细胞

浓度: 0-10 μ M, 溶于 DMSO

处理时间: 72 小时

方法: 细胞按每孔 3×10^3 - 1×10^4 个接种在 96 孔板上。第二天, 加入 HMN-214 或 HMN-176 稀释液, 温育 72 小时。通过 MTT 实验测定对细胞生长的抑制情况, 获得 IC₅₀ 值。

五、动物实验

动物模型: 携带 PC-3, A549, 和 WiDr 移植瘤的雄性 BALB/c 裸鼠

剂量: 10 mg/kg-20 mg/kg

给药处理: 口服饲喂

注意事项:





Beijing Psaitong
Biotechnology Co., Ltd

- | |
|-----------------------------|
| 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℃

*更多产品请登陆官网查询。
*本公司产品仅用于科研。

真实 准确 稳定 负责

010-60605840
www.jm-bio.com
psaitong@jm-bio.com

