

MLN9708 (MLN-9708; Ixazomib)

产品信息

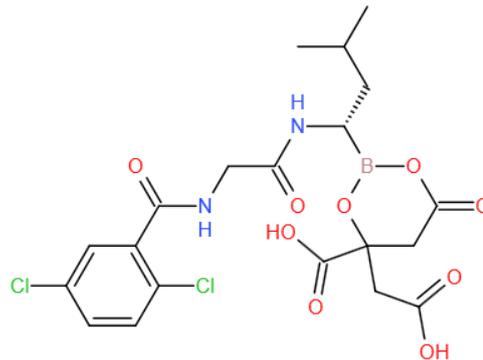
产品名称	产品编号	规格
MLN9708 (MLN-9708; Ixazomib)	52803ES08	5 mg
	52803ES25	25 mg

产品描述

MLN9708 (MLN-9708; Ixazomib), 是小分子 proteasome 抑制剂。MLN9708 是一种柠檬酸盐, 在水溶液或血浆中立即水解为具有生物活性的 MLN2238。MLN2238 结合并抑制 20S proteasome, 主要抑制 20S proteasome 的胰凝乳蛋白酶等蛋白水解位点(β 5) (IC_{50} =3.4 nM, K_i =0.93 nM), 对 β 1 作用稍弱, 对 β 2 几乎没有抑制活性。在血液系统和实体瘤移植模型中, MLN9708 表现出有效的抗肿瘤活性和细胞毒性作用, 诱导细胞自噬及 MKP-1 表达, 并提高 Dox 诱导的细胞凋亡。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	4-(carboxymethyl)-2-((R)-1-(2-(2,5-dichlorobenzamido)acetamido)-3-methylbutyl)-6-oxo-1,3,2-dioxaborinane-4-carboxylic acid; MLN-9708, Ixazomib
中文名称 (Chinese Name)	艾沙佐米柠檬酸盐
靶点 (Target)	20S proteasome
CAS 号 (CAS NO.)	1201902-80-8
分子式 (Formula)	$C_{20}H_{23}BCl_2N_2O_9$
分子量 (Molecular Weight)	517.12
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	易溶于 DMSO: ≥ 50 mg/mL
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C , 有效期 2 年。建议分装后 -20°C 避光保存, 避免反复冻融。

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) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

为检测 MLN9708 对乳腺癌细胞系的抗肿瘤作用，用培养基（对照）或不同浓度的 MLN9708（0.001 μ M–10 μ M）处理 8 种乳腺癌细胞 72 h，细胞分别为 T-47D, MCF7, MDA-MB-361, SK-BR-3, HCC1954, MDA-MB-468, MDA-MB-231, BT-549。结果表明，MLN9708 降低所有乳腺癌细胞的活力，其作用方式为剂量依赖型。并且在细胞克隆形成实验中，MLN9708 处理的细胞增殖明显变慢。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

1) 建立 RPMI8226-luc 细胞小鼠移植瘤模型，口服 5% 2-hydroxypropyl- β -cyclodextrin，每周 3 次（对照），实验组口服 MLN2238（7.5 mg/kg，每周 2 次），与对照组相比，MLN2238 有效控制肿瘤增殖。^[2]

2) 建立人 MM.1S 移植瘤小鼠模型，给小鼠静脉注射 MLN9708/MLN2238（11 mg/kg），发现 MLN9708/MLN2238 显著抑制 MM 肿瘤生长，并延长小鼠存活率。^[3]

参考文献

- [1]. Hao Wang, et al. Next-generation proteasome inhibitor MLN9708 sensitizes breast cancer cells to doxorubicin-induced apoptosis. *Scientific Reports* 6, Article number: 26456 (2016).
- [2]. A. Garcia-Gomez, et al. Preclinical activity of the oral proteasome inhibitor MLN9708 in Myeloma bone disease. *Clin. Cancer Res.* 20(6): 1542-1554 (2014).
- [3]. Dharminder Chauhan, et al. In Vitro and In Vivo Selective Antitumor Activity of a Novel Orally Bioavailable Proteasome Inhibitor MLN9708 against Multiple Myeloma Cells. *Clin Cancer Res.* 17(16): 5311-5321 (2011).