



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: MD-224
CAS 号: 2136247-12-4
产品货号: S87671

生物活性:

Description	MD-224 是基于蛋白水解定位嵌合体 (PROTAC) 的高效小分子 (MDM2) 降解物。MD-224 由 Cereblon 和 MDM2 配体组成。MD-224 在人白血病细胞中, 诱导 MDM2 的快速降解 (<1 nM), 抑制 RS4;11 细胞生长的 IC ₅₀ 值为 1.5 nM。MD-224 有可能成为一类新的抗癌剂。			
IC ₅₀ & Target[1]	MDM2 1 nM (IC ₅₀)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	KG-1	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of cell growth in human KG-1 cells harbouring mutant p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	ML-2	IC ₅₀	4.4 μM	Inhibition of cell growth in human ML-2 cells harbouring wild-type p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	MOLM-13	IC ₅₀	7.3 μM	Inhibition of cell growth in human MOLM-13 cells harbouring wild-type p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	MOLM-14	IC ₅₀	10.5 μM	Inhibition of cell growth in human MOLM-14 cells harbouring wild-type p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	MONO-MAC-6	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of cell growth in human MONO-MAC-6 cells harbouring mutant p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	OCI-AML-5	IC ₅₀	33.1 μM	Inhibition of cell growth in human OCI-AML5 cells harbouring wild-type p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
	RS4-11	IC ₅₀	1.5 nM	Inhibition of cell growth in human RS4-11 cells incubated for 4 days by Lactate dehydrogenase based WST-8 assay
	SIG-M5	IC ₅₀	19.8 μM	Inhibition of cell growth in human SIG-M5 cells harbouring wild-type p53 incubated for 4 days by lactate dehydrogenase-based WST-8 assay
In Vitro	MD-224 (1-30 nM; 2 小时) 可有效诱导 RS4;11 细胞中 MDM2 蛋白的消耗, 并同时诱导 p53 蛋白的积累, 且这种诱导作用呈剂量依赖性[1]。			
	MD-224 (30 nM; 6 小时) 在诱导这些 p53 靶基因转录上调方面比 MI-1061 更有效, 但对 RS4;11 细胞中的 TP53 本身没有影响[1]。			
	MD-224 (0.001-1 μM; 24 小时) 在 ≤10 nM 的浓度下, 经 24 小时治疗后, 即可以剂量依赖性方式诱导强烈细胞凋亡[1]。			
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	RS4;11 cells		
Concentration:		1 nM; 3 nM; 10 nM; 30 nM		
Incubation Time:		2 hours		



	Result:		Decreased MDM2 protein and accumulated of p53 protein.		
	RT-PCR[1]				
	Cell Line:		RS4;11 cells		
	Concentration:		30 nM		
	Incubation Time:		6 hours		
	Result:		Upregulated p53 target gene expression.		
	Apoptosis Analysis[1]				
	Cell Line:		RS4;11 cells		
	Concentration:		0.001 μM, 0.003 μM, 0.01 μM, 0.03 μM, 0.1 μM, 0.3 μM, 1 μM		
	Incubation Time:		24 hours		
	Result:		Induces robust apoptosis in RS4;11 cells.		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (112.38 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.1238 mL	5.6192 mL	11.2385 mL
		5 mM	0.2248 mL	1.1238 mL	2.2477 mL
		10 mM	0.1124 mL	0.5619 mL	1.1238 mL
*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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。					
参考文献	[1]. Li Y, et al. Discovery of MD-224 as a First-in-Class, Highly Potent, and Efficacious Proteolysis Targeting Chimera Murine Double Minute 2 Degradable Capable of Achieving Complete and Durable Tumor Regression. J Med Chem. 2019 Jan 24;62(2):448-466.				
完整储备液配制表: 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。 储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。					
可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.1238 mL	5.6192 mL	11.2385 mL	28.0962 mL
	5 mM	0.2248 mL	1.1238 mL	2.2477 mL	5.6192 mL
	10 mM	0.1124 mL	0.5619 mL	1.1238 mL	2.8096 mL
	15 mM	0.0749 mL	0.3746 mL	0.7492 mL	1.8731 mL
	20 mM	0.0562 mL	0.2810 mL	0.5619 mL	1.4048 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	25 mM	0.0450 mL	0.2248 mL	0.4495 mL	1.1238 mL
	30 mM	0.0375 mL	0.1873 mL	0.3746 mL	0.9365 mL
	40 mM	0.0281 mL	0.1405 mL	0.2810 mL	0.7024 mL
	50 mM	0.0225 mL	0.1124 mL	0.2248 mL	0.5619 mL
	60 mM	0.0187 mL	0.0937 mL	0.1873 mL	0.4683 mL
	80 mM	0.0140 mL	0.0702 mL	0.1405 mL	0.3512 mL
	100 mM	0.0112 mL	0.0562 mL	0.1124 mL	0.2810 mL



源叶