



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: shyysw@sina.com

产品名称: **MZ 1**
CAS 号: **1797406-69-9**
产品货号: **S88491**

生物活性:

Description	MZ 1 是由 von Hippel-Lindau 配体和 BRD4 配体相连的 PROTAC。MZ 1 强效迅速地诱导 BRD4 降解,选择性高于 BRD2 和 BRD3。对 BRD4 BD1/2, BRD3 BD1/2 和 BRD2 BD1/2 的 Kd 分别为 382/120, 119/115 和 307/228 nM。				
IC50 & Target	Kd: 382/120 nM (BRD4 BD1/2), 119/115 nM (BRD3 BD1/2), 307/228 nM (BRD2 BD1/2)[1].				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	EOL1	IC ₅₀	1.5 nM	Antiproliferative activity against human EOL1 cells assessed as inhibition of cell growth	
	HL-60	IC ₅₀	1.5 nM	Antiproliferative activity against human HL-60 cells assessed as inhibition of cell growth	
	HeLa	DC ₅₀	< 100 nM	Protac activity at VHL/BRD4 in human HeLa cells assessed as induction of BRD4 protein degradation incubated for 24 hrs by Western blot analysis	
	MV4-11	IC ₅₀	11.3 nM	Antiproliferative activity against human MV4-11 cells	
In Vitro	MZ 1 通过 3 单位 PEG 接头[2]将 pan-BET 抑制剂 JQ1 与 VH032 (一种有效且特异性的 VHL 配体) 偶联。				
	MZ 1 (100 和 250 nM; 24 小时) 在 LS174t 细胞中诱导 BRD4 降解 24 小时。MZ 1 导致 BRD4 蛋白完全降解, 而 BRD4 mRNA 的表达没有降低[3]。				
	Western Blot Analysis[3]				
	Cell Line:	LS174t cells			
	Concentration:	0, 100, and 250 nM			
	Incubation Time:	24 hours			
Result:	Led to complete degradation of BRD4 protein, whereas the expression of BRD4 mRNA was not reduced.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (99.74 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	0.9974 mL	4.9868 mL	9.9737 mL
		5 mM	0.1995 mL	0.9974 mL	1.9947 mL
		10 mM	0.0997 mL	0.4987 mL	0.9974 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, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
	动物实验:				
	请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。				
以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂:					
——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建					



	请您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (2.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (2.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (2.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Zengerle M, et al. Selective Small Molecule Induced Degradation of the BET Bromodomain Protein BRD4. ACS Chem Biol. 2015 Aug 21;10(8):1770-7. [2]. Gadd MS, et al. Structural basis of PROTAC cooperative recognition for selective protein degradation. Nat Chem Biol. 2017 May;13(5):514-521. [3]. Otto C, et al. Targeting bromodomain-containing protein 4 (BRD4) inhibits MYC expression in colorectal cancer cells. Neoplasia. 2019 Nov;21(11):1110-1120.

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, 6 months; -20° C, 1 month (stored under nitrogen)。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	0.9974 mL	4.9868 mL	9.9737 mL	24.9342 mL
	5 mM	0.1995 mL	0.9974 mL	1.9947 mL	4.9868 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

	10 mM	0.0997 mL	0.4987 mL	0.9974 mL	2.4934 mL
	15 mM	0.0665 mL	0.3325 mL	0.6649 mL	1.6623 mL
	20 mM	0.0499 mL	0.2493 mL	0.4987 mL	1.2467 mL
	25 mM	0.0399 mL	0.1995 mL	0.3989 mL	0.9974 mL
	30 mM	0.0332 mL	0.1662 mL	0.3325 mL	0.8311 mL
	40 mM	0.0249 mL	0.1247 mL	0.2493 mL	0.6234 mL
	50 mM	0.0199 mL	0.0997 mL	0.1995 mL	0.4987 mL
	60 mM	0.0166 mL	0.0831 mL	0.1662 mL	0.4156 mL
	80 mM	0.0125 mL	0.0623 mL	0.1247 mL	0.3117 mL



源叶