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：ZM223
CAS 号：2031177-48-5
产品货号：S88553

生物活性：

Description	ZM223 是一种有效的非共价 NEDD8 活化酶 (NAE) 抑制剂，具有口服活性。
IC50 & Target	NEDD8 activating enzyme (NAE)[1]

Cellular Effect

Cell Line	Type	Value	Description
A549	IC_{50}	41.23 μM	Antiproliferative activity against human A549 cells by CCK8 assay
HCT-116	IC_{50}	0.1 μM	Antitumor activity against human HCT116 cells after 72 hrs by MTT assay
KYSE-30	IC_{50}	17.38 μM	Antiproliferative activity against human KYSE-30 cells by CCK8 assay
MCF7	IC_{50}	> 100 μM	Antiproliferative activity against human MCF7 cells by CCK8 assay
MGC-803	IC_{50}	4.91 μM	Antiproliferative activity against human MGC-803 cells by CCK8 assay
U2OS	IC_{50}	1.22 μM	Antitumor activity against human U2OS cells after 72 hrs by MTT assay

In Vitro

ZM223 (0.1-1 μM; 4 hours) inhibits both HCT-116 and U-2OS cancer cells with IC50s of 100 and 122 nM, respectively[1].

ZM223 (0.1-1 μM; 4 hours) causes a dose-response decrease in the level of NEDD8 and accumulation of the UBC12 protein, indicating the decrease of the subsequent NEDD8-UBC12 complex[1]。

Cell Viability Assay[1]

Cell Line:	HCT116 colon cancer cells and U-2OS osteosarcoma cells
Concentration:	0.1 μM, 1 μM
Incubation Time:	4 hours
Result:	Inhibited both HCT-116 and U-2OS cancer cells.

Western Blot Analysis[1]

Cell Line:	HCT116 colon cancer cells
Concentration:	0.1 μM, 1 μM
Incubation Time:	4 hours
Result:	Caused a decrease in the level of NEDD8 and an increase in the downstream UBC12 protein.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (165.82 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	1.9899 mL	9.9497 mL	19.8993 mL
	5 mM	0.3980 mL	1.9899 mL	3.9799 mL
	10 mM	0.1990 mL	0.9950 mL	1.9899 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：shyysw@sina.com

	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，建议您现用现配，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: ≥ 2.08 mg/mL (4.14 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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。
参考文献	[1]. Ma H, et al. Discovery of benzothiazole derivatives as novel non-sulfamide NEDD8 activating enzyme inhibitors by target-based virtual screening. Eur J Med Chem. 2017 Jun 16;133:174-183.

完整储备液配制表：

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	1.9899 mL	9.9497 mL	19.8993 mL	49.7483 mL
	5 mM	0.3980 mL	1.9899 mL	3.9799 mL	9.9497 mL
	10 mM	0.1990 mL	0.9950 mL	1.9899 mL	4.9748 mL
	15 mM	0.1327 mL	0.6633 mL	1.3266 mL	3.3166 mL
	20 mM	0.0995 mL	0.4975 mL	0.9950 mL	2.4874 mL
	25 mM	0.0796 mL	0.3980 mL	0.7960 mL	1.9899 mL
	30 mM	0.0663 mL	0.3317 mL	0.6633 mL	1.6583 mL
	40 mM	0.0497 mL	0.2487 mL	0.4975 mL	1.2437 mL
	50 mM	0.0398 mL	0.1990 mL	0.3980 mL	0.9950 mL
	60 mM	0.0332 mL	0.1658 mL	0.3317 mL	0.8291 mL
	80 mM	0.0249 mL	0.1244 mL	0.2487 mL	0.6219 mL
	100 mM	0.0199 mL	0.0995 mL	0.1990 mL	0.4975 mL