



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: **M22 NEDD8 inhibitor; NAE-IN-M22**

CAS 号: **864420-54-2**

产品货号: **S89147**

生物活性:				
Description	NAE-IN-M22 是一种有效, 选择性和可逆的 NEDD8 活化酶 (NAE) 抑制剂, 效力在微摩尔范围内。NAE-IN-M22 抑制多种癌细胞生长并诱导 A549 细胞凋亡。NAE-IN-M22 还可以在体内抑制肿瘤的生长。			
IC50 & Target	NEDD8 activating enzyme (NAE)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A549	IC ₅₀	5.55 μM	Antiproliferative activity against human A549 cells after 48 hrs by CCK8 assay
	AGS	IC ₅₀	9.92 μM	Antiproliferative activity against human AGS cells after 48 hrs by CCK8 assay
	BXPC-3	IC ₅₀	12.4 μM	Antiproliferative activity against human BxPC3 cells after 48 hrs by CCK8 assay
	HCT-116	IC ₅₀	10.57 μM	Antiproliferative activity against human HCT116 cells after 48 hrs by CCK8 assay
	K562	IC ₅₀	5.51 μM	Antiproliferative activity against human K562 cells after 48 hrs by CCK8 assay
	SK-OV-3	IC ₅₀	9.26 μM	Antiproliferative activity against human SKOV3 cells after 48 hrs by CCK8 assay
In Vitro	M22 (0.37-90 μ M; 24 h) blocks neddylation pathway selectively and suppresses degradation of CRL substrates in A549 cells[1].			
	M22 (0.1-100 μ M; 48 h) inhibits A549 cell proliferation completely at 30 μM (GI50=5.5 μM, GI90=19.3 μM)[1].			
	M22 (15-30 μ M; 36 h) promotes apoptosis in A549 cell line[1]。			
	Cell Viability Assay[1]			
	Cell Line:	A549 cells		
	Concentration:	0.37, 1.11, 3.33, 10, 30, 90 μM		
	Incubation Time:	24 hours		
Result:	Inhibited formations of Uba3-NEDD8 and Ubc12-NEDD8.			
	Resulted in a corresponding decrease in the abundance of Cullins-NEDD8.			
	Decreased the degradations of p27 and CDT1.			
	Prevented p53 from degradation.			
In Vivo	M22 (60 mg/kg; i.p. once daily for 14 d) inhibits tumor growth in nude mice bearing AGS xenografts[1].			
	M22 (0.36-90 μ M) has low acute toxicity in zebrafish model[1].			
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (688.10 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)			
	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg



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

	Preparing	1 mM	2.7524 mL	13.7620 mL	27.5239 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5505 mL	2.7524 mL	5.5048 mL
		10 mM	0.2752 mL	1.3762 mL	2.7524 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。-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 (5.72 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.72 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 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.72 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，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 20.8 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]. Lu P, et, al. Discovery of a novel NEDD8 Activating Enzyme Inhibitor with Piperidin-4-amine Scaffold by Structure-Based Virtual Screening. ACS Chem Biol. 2016 Jul 15;11(7):1901-7.				

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。-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。



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.7524 mL	13.7620 mL	27.5239 mL	68.8099 mL
	5 mM	0.5505 mL	2.7524 mL	5.5048 mL	13.7620 mL
	10 mM	0.2752 mL	1.3762 mL	2.7524 mL	6.8810 mL
	15 mM	0.1835 mL	0.9175 mL	1.8349 mL	4.5873 mL
	20 mM	0.1376 mL	0.6881 mL	1.3762 mL	3.4405 mL
	25 mM	0.1101 mL	0.5505 mL	1.1010 mL	2.7524 mL
	30 mM	0.0917 mL	0.4587 mL	0.9175 mL	2.2937 mL
	40 mM	0.0688 mL	0.3440 mL	0.6881 mL	1.7202 mL
	50 mM	0.0550 mL	0.2752 mL	0.5505 mL	1.3762 mL
	60 mM	0.0459 mL	0.2294 mL	0.4587 mL	1.1468 mL
	80 mM	0.0344 mL	0.1720 mL	0.3440 mL	0.8601 mL
	100 mM	0.0275 mL	0.1376 mL	0.2752 mL	0.6881 mL

源叶