



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: shyyw@sina.com

产品名称: **ZX-29**
CAS 号: **2254805-62-2**
产品货号: **S89362**

生物活性:

Description	ZX-29 是一种有效的选择性的 ALK 抑制剂, 对 ALK, ALK L1196M 和 ALK G1202R 的 IC50 分别为 2.1 nM, 1.3 nM 和 3.9 nM, 但对 EGFR 无活性。ZX-29 通过诱导内质网应激来诱导细胞凋亡 (apoptosis), 并克服了由 ALK 突变引起的细胞抗性。ZX-29 还可诱导保护性自噬 (autophagy) 并具有抗肿瘤作用。	
IC50 & Target	IC50: 2.1 nM (ALK), 1.3 nM (ALK L1196M) and 3.9 nM (ALK G1202R)[1]	
In Vitro	ZX-29 (0-81 nM; 24-72 小时; NCI-H2228 细胞) 处理导致 NCI-H2228 细胞活力呈时间和剂量依赖性降低[1]。	
	ZX-29 (10 nM; 24 小时; NCI-H2228 细胞) 处理导致自噬的典型迹象和自噬体的形成。ZX-29 增强 LC3 和 Beclin1 的表达水平[1]。	
	ZX-29 (10 nM; 0-48 小时; NCI-H2228 细胞) 抑制 NCI-H2228 的增殖细胞并使细胞停滞在 G1 期[1]。	
	ZX-29 (10-40 nM; 24-48 小时; NCI-H2228 细胞) 处理诱导 NCI-H2228 细胞凋亡。ZX-29 剂量依赖性地上调促凋亡蛋白 Bax 的表达水平, 增加活化形式的 caspase 3 的产生, 并下调抗凋亡蛋白 Bcl-2 的表达水平[1]。	
	ZX-29 (30-300 nM; 24 小时; NCI-H2228 细胞) 处理以剂量依赖性方式显著下调 p-ALK 及其下游信号蛋白 (包括 p-Akt 和 p-STAT3) 的表达[1]。	
	ZX-29 (20 nM; 0-48 小时; NCI-H2228 细胞) 处理显著增加 CHOP 的 mRNA 水平[1]。	
	ZX-29 剂量依赖性地抑制 NCI-H2228 细胞的集落形成。随着 ZX-29 浓度的增加, 细胞密度逐渐降低, 细胞失去正常形态, 变得尖锐细长[1]。	
	Cell Viability Assay[1]	
	Cell Line:	NCI-H2228 cells
	Concentration:	0 nM, 1 nM, 3 nM, 9 nM, 10 nM, 27 nM or 81 nM
	Incubation Time:	24 hours, 48 hours or 72 hours
	Result:	Led to a time- and dose-dependent decrease in NCI-H2228 cell viability.
	Cell Autophagy Assay[1]	
	Cell Line:	NCI-H2228 cells
	Concentration:	10 nM
	Incubation Time:	24 hours
Result:	Caused typical signs of autophagy and the formation of autophagosomes.	
Cell Cycle Analysis[1]		
Cell Line:	NCI-H2228 cells	
Concentration:	0 hour, 12 hours, 24 hours or 48 hours	
Incubation Time:	24 hours	
Result:	Arrested the NCI-H2228 cells in G1 phase in a time-dependent manner.	
Apoptosis Analysis[1]		
Cell Line:	NCI-H2228 cells	



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

	Concentration:	10 nM, 20 nM or 40 nM			
	Incubation Time:	24 hours, 48 hours			
	Result:	Promoted NCI-H2228 cell apoptosis in a dose-dependent manner.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	NCI-H2228 cells			
	Concentration:	30 nM, 100 nM, 300 nM			
	Incubation Time:	24 hours			
	Result:	Significantly down-regulated the expression of p-ALK and its downstream signaling proteins, including p-Akt and p-STAT3, in a dose-dependent manner.			
	RT-PCR[1]				
	Cell Line:	NCI-H2228 cells			
	Concentration:	20 nM			
	Incubation Time:	0 hour, 6 hours, 12 hours, 24 hours or 48 hours			
	Result:	The mRNA level of CHOP was increased significantly.			
In Vivo	ZX-29 (50 mg/kg; 灌胃; 每 2 天一次; 共 7 次; 雌性 BALB/c 裸鼠) 处理抑制小鼠异种移植模型中的肿瘤生长[1]。				
	Animal Model:	Female BALB/c nude mice (4-week-old) with H2228 cells[1]			
	Dosage:	50 mg/kg			
	Administration:	Intragastric administration; every 2 days; for a total of 7 times			
	Result:	Showed significantly attenuated tumor growth.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (96.52 mM); 超声助溶 (<60°C); 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	1.9304 mL	9.6519 mL	19.3039 mL
		5 mM	0.3861 mL	1.9304 mL	3.8608 mL
		10 mM	0.1930 mL	0.9652 mL	1.9304 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 (protect from light)。-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					



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

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.83 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。
参考文献	[1]. Gou W, et al. ZX-29, a novel ALK inhibitor, induces apoptosis via ER stress in ALK rearrangement NSCLC cells and overcomes cell resistance caused by an ALK mutation. Biochim Biophys Acta Mol Cell Res. 2020 Mar 26;1867(7):118712.

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 (protect from light)。-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	1.9304 mL	9.6520 mL	19.3039 mL	48.2598 mL
	5 mM	0.3861 mL	1.9304 mL	3.8608 mL	9.6520 mL
	10 mM	0.1930 mL	0.9652 mL	1.9304 mL	4.8260 mL
	15 mM	0.1287 mL	0.6435 mL	1.2869 mL	3.2173 mL
	20 mM	0.0965 mL	0.4826 mL	0.9652 mL	2.4130 mL
	25 mM	0.0772 mL	0.3861 mL	0.7722 mL	1.9304 mL
	30 mM	0.0643 mL	0.3217 mL	0.6435 mL	1.6087 mL
	40 mM	0.0483 mL	0.2413 mL	0.4826 mL	1.2065 mL
	50 mM	0.0386 mL	0.1930 mL	0.3861 mL	0.9652 mL
	60 mM	0.0322 mL	0.1609 mL	0.3217 mL	0.8043 mL
	80 mM	0.0241 mL	0.1206 mL	0.2413 mL	0.6032 mL