

CB839 ; CB-839

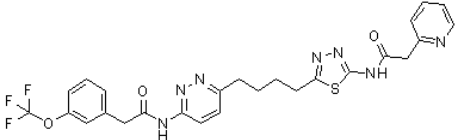
产品编号：MB3226

质量标准：>98%,glutaminase 抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：灰白色至黄色(固体)

基本信息

分子式	C26H24F3N7O3S	结 构 式	
分子量	571.57		
CAS No.	1439399-58-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL warmed (174.95 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 :CB-839 是可口服 非竞争性的谷氨酰胺酶 1 (glutaminase 1 (GLS1)) 剪接变体 KGA 和 GAC 的抑制剂，IC₅₀ 值分别为 23 nM 和 28 nM。

别名：2-Pyridineacetamide,

N-[5-[4-[6-[[2-[3-(trifluoromethoxy)phenyl]acetyl]amino]-3-pyridazinyl]butyl]-1,3,4- thiadiazol-2-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....灰白色至黄色(固体)

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL warmed (174.95 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	CB-839 是一种有效的，选择性的，口服生物可利用的 glutaminase 抑制剂，对重组人 GAC 的 IC ₅₀ 为 24 nM。
靶点	glutaminase
IC ₅₀	24 nM
体外研究	CB-839 表现出时间依赖性和缓慢可逆的动力学特性。与 rHu-GAC 预培养 1 小时后，CB-839 抑制谷氨酰胺酶的 IC ₅₀ 值 < 50 nmol/L，至少比 BPTES 低 13 倍。CB-839 对三阴性乳腺癌 (TNBC) 细胞系，HCC-1806，具有抗增殖活性，而对雌激素受体阳性细胞系，T47D，没有抗增殖活性。
体内研究	在小鼠 TNBC 模型中，单剂 CB-839 (200 mg/kg, p.o.) 抑制相对于载体对照 61% 的肿瘤生长。在小鼠 JIMT-1 异种移植模型中，CB-839 单独用药 (200 mg/kg, p.o.) 导致相对载体对照 54% 的肿瘤生长抑制 (TGI)，CB-839 (200 mg/kg, p.o.) 和 paclitaxel (10 mg/kg, p.o.) 联合用药很大程度上抑制肿瘤的再生长，相对于载体对照，引起 100% 的肿瘤生长抑制 (TGI)。

美仑相关产品推荐

MB2348	BPTES
--------	-------

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。CB-839 是可口服，非竞争性的谷氨酰胺酶 1 (glutaminase 1 (GLS1)) 剪接变体 KGA 和 GAC 的抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.7496 mL	8.7478 mL	17.4957 mL
5 mM		0.3499 mL	1.7496 mL	3.4991 mL
10 mM		0.1750 mL	0.8748 mL	1.7496 mL
50 mM		0.0350 mL	0.1750 mL	0.3499 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>CB-839 对 rHu-GAC 的抑制: 酶活性在包含 50 mM Tris-Acetate pH 8.6, 150 mM K₂HPO₄, 0.25 mM EDTA, 0.1 mg/mL 牛血清蛋白, 1 mM DTT, 2 mM NADP⁺ 和 0.01% Triton X-100 的实验缓冲液中测量。为测量抑制, 抑制剂(在 DMSO 中制备)首先与谷氨酸盐和谷氨酸脱氢酶(GDH)预混合, 反应通过加入 rHu-GAC 启动。终反应包含 2 nM rHu-GAC, 10 mM 谷氨酸盐, 6 units/mL GDH 和 2% DMSO。NADPH 的产生通过每 15 分钟的荧光反应(Ex340/Em460 nm)在 SpectraMax M5e 酶标仪上监测。相对荧光单元(RFU)使用 NADPH 标准曲线转化为 NADPH 浓度(μM)单位。每个试验板结合对照反应监测谷氨酸盐(1 到 75 μM)与 NADP⁺通过 GDH 转化为 α-酮戊二酸与 NADPH。在这些试验条件下, 高达 75 μM 谷氨酸盐按照化学计量通过 GDH 转化为 α-酮戊二酸/NADPH。初反应速度通过将每个反应进行曲线前 5 分钟拟合为直线计算。抑制曲线拟合为四参数剂量反应方程: 活性百分比=底部+(顶部-底部)/(1+10^{^((LogIC50-X)*HillSlope))}。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: HCC1806, MDA-MB-231, 和 T47D 细胞 Concentrations: 0.1-1000 nM Incubation Time: 72 h Method: 对于活性试验, 所有细胞系用指示浓度的 CB-839 处理 72 小时, 并使用 Cell Titer Glo 分析抗增殖作用。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 负荷 TNBC 或 JIMT-1 异种移植物的雌性 Scid/Bg 小鼠 Formulation: 含 25% (w/v) 羟丙基-β-环糊精(HPBCD)的 10 mmol/L 柠檬酸盐, pH 2 Dosages: 200 mg/kg Administration: p.o.</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。