

CB-5083

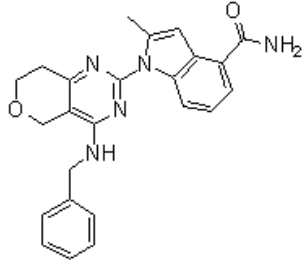
产品编号：MB3713

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C24H23N5O2	结 构 式	
分子量	413.47		
CAS No.	1542705-92-9		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO：82 mg/mL (198.32 mM) Water：Insoluble Ethanol：13 mg/mL warmed (31.44 mM)		
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-5083 是有效，选择性和有口服活性的 p97 抑制剂，IC₅₀ 值为 11 nM。**别名：**1H-Indole-4-carboxamide, 1-[7,8-dihydro-4-[(phenylmethyl)amino]-5H-pyrano[4,3-d]pyrimidin-2-yl]-2-methyl**物理性状及指标：**

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 82 mg/mL (198.32 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 13 mg/mL warmed (31.44 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥**生物活性**

产品描述	CB-5083 是一种有效的，选择性的，且口服具有生物活性的 p97 AAA ATPase 抑制剂，IC ₅₀ 为 11 nM。
靶点	p97 AAA ATPase (Cell-free assay) 11 nM
体外研究	在 A549 细胞，CB-5083 引起显著的 K48 聚泛素化蛋白和 CHOP 的积累，以及 p62 的减

	少，并杀死肿瘤细胞，IC50 为 680 nM。
体内研究	在负荷人 HCT 116 结肠癌异种移植物的 小鼠中，CB-5083 (75 mg/kg, p.o.) 显著抑制肿瘤生长。在负荷成熟的人 AMO-1 多发性骨髓瘤和 A549 肺癌肿瘤移植物的 小鼠中，CB-5083 (100 mg/kg, p.o.) 也会导致显著的肿瘤生长抑制。

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-5083 是有效，选择性和有口服活性的 **p97** 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4186 mL	12.0928 mL	24.1856 mL
5 mM	0.4837 mL	2.4186 mL	4.8371 mL
10 mM	0.2419 mL	1.2093 mL	2.4186 mL
50 mM	0.0484 mL	0.2419 mL	0.4837 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	ATPase 试验: 化合物在 DMSO 中从 10 μ M 开始以 3 倍 10 点连续稀释。测定在 384 孔板中进行，每行作为单一稀释系列，每个化合物浓度点重复两份。在 5 μ L 总体积中，加入 20 nM p97 六聚体酶和 20 μ M ATP 以起始反应。将板密封，在定轨摇床上完全混合后在 37 $^{\circ}$ C 下培育 15 分钟。化合物稀释，ATP 和酶添加使用 Freedom Evo 自动液体输送进行。ADP Glo 试剂 1 和 2 根据制造商说明加入。荧光通过 Envision 酶标仪在反应终点测量。每个化合物的 IC50 通过将荧光值拟合到四参数 S 形曲线推导。
细胞实验	Cell lines: A549 细胞 Concentrations: ~40.0 μ M Incubation Time: 72 小时 Method: A549 和其他肿瘤细胞系根据 ATCC 指引进行培养。细胞在黑色或白色，透明底，组织培养基处理的 384 孔板中培养。细胞重复两份以 10 点不同剂量滴定处理。处理 72 小时后，将 CellTiter-Glo 加入白孔中以测量细胞活性。荧光值拟合为四参数 S 形曲线以测定 IC50 浓度。
动物实验	Animal Models: 负荷人 HCT 116 结肠肿瘤异种移植物的 Nu/Nu 雌性裸鼠 Formulation: 悬浮在包含 0.5% 甲基纤维素的水中 Dosages: 75 mg/kg, qd Administration: p.o.

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在200转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。