

NMS 873 ; NMS-873

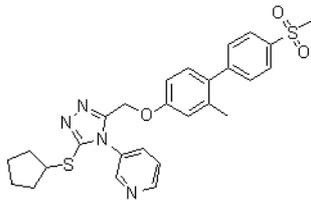
产品编号 : MB3807

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

| | | | |
|---------------|---------------------------------|-------------|---|
| 分子式 | C27H28N4O3S2 | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 520.67 | | |
| CAS No. | 1418013-75-8 | | |
| 储存条件 | -20°C, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 100 mg/mL (192.06 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 : NMS-873 是一种有效, 选择性的 VCP/p97 变构抑制剂。

别名 : 3-[3-(Cyclopentylthio)-5-[[[2-methyl-4'-(methylsulfonyl)[1,1'-biphenyl]-4-yl]oxy]methyl]-4H-1,2,4-triazol-4-yl]-pyridine

物理性状及指标 :

外观 :类白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (192.06 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 | NMS-873 是特异性 p97 的变构抑制剂, IC50=30nM, 对 VCP/p97 的选择性相对于对其他 AAA ATPase、Hsp90 和其他所检测激酶较高。 |
| 特性 | 目前为止最有效的特定 p97 抑制剂。 |
| 靶点 | p97 (Cell-free assay) 30 nM |

| | |
|-------------|--|
| 体外研究 | NMS-873 降低 p97 对胰蛋白酶消化的敏感性，防止连接器 D2 域的退化。NMS-873，作为 p97 抑制剂，产生对各种血液的和固体肿瘤系的抗增殖活性。作用机制研究表明，NMS-873 激活未折叠蛋白反应，干扰自噬，从而诱导癌症细胞死亡。 |
|-------------|--|

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。本品 NMS-873 是一种有效，选择性的 VCP/p97 变构抑制剂。可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体 浓度 | 质量 积 | | |
|---------|-----------|-----------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 1.9206 mL | 9.6030 mL | 19.2060 mL |
| 5 mM | 0.3841 mL | 1.9206 mL | 3.8412 mL |
| 10 mM | 0.1921 mL | 0.9603 mL | 1.9206 mL |
| 50 mM | 0.0384 mL | 0.1921 mL | 0.3841 mL |

经典实验操作（仅供参考）

| | |
|-------------|--|
| 激酶实验 | <p>生化检测和高通量筛选:</p> <p>ATPase 活性和重组野生型 VCP 与其突变体的动力学参数通过检测反应中 ADP 的形成评估，使用修改的 NADH 偶联测定法。ADP 和 NADH 是 VCP ATPase 活性的 ATP 竞争性抑制剂，NADH 偶联测定法的标准协议被修改为两个步骤。在第一部分，ATP 产生系统(40 U/ml 丙酮酸激酶和 3 mM 磷酸烯醇丙酮酸盐)回收 VCP 活动产生的 ADP，保持底物浓度恒定(因此防止产物抑制)，并积累化学计量的丙酮酸盐。在第二部分，VCP 酶反应用 30 mM EDTA 和 250 μM NADH 淬灭，并被 40 U/ml 乳酸脱氢酶以化学计量氧化以减少积累的丙酮酸盐。NADH 浓度的减少在 340 nm 下使用 Tecan Safire 2 阅读板进行测定。该测试在 96 孔或 384 孔 UV 板上在含有 50 mM HEPES, pH 7.5, 0.2 毫克/毫升 BSA, 10 mM MgCl₂ 和 2 mM DTT 的反应缓冲液中进行。实验数据符合协同方程式，得到的 K_s* 大约为 60 μM，和希尔系数为 2.0 ± 0.1。对 1 亿化合物库的高通量筛选以 1,536 孔格式的微型试验进行，并使用更灵敏的 ADP 检测系统，Transcreener ADP FP。加入 10 μM ATP 到反应中后，对 10 nM VCP 和 10 μM 抑制剂预培养 20 分钟，其在淬灭前允许进行 90 分钟。</p> |
| 细胞实验 | <p>Cell lines: 各种各样的血液和实体肿瘤系</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 细胞以 1,600 细胞每孔接种于 384 孔白色透明底平板。接种后 24 小时，细胞用化合物(每种化合物，重复两份，稀释成 8 个不同浓度)进行处理，并在 37 °C 下于 5% CO₂ 大气中再培育 72 小时。然后将细胞裂解，每孔中 ATP 含量通过基于热稳定的萤火虫荧光素酶检测，作为细胞活性的量度来确定。IC₅₀ 值使用处理过的细胞相对于未处理过的对照组的</p> |

生长百分比来计算

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做好预处理，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，否则会严重影响化合物活性，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(M ²) | 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。