

GMX1778 (CHS828)

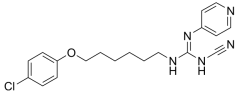
产品编号: MB4257

质量标准: >98%,BR

包装规格: 10mg / 50mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₁₉ H ₂₂ ClN ₅ O	结 构 式	
分子量	371.86		
CAS No.	200484-11-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	湿冰运输		

简介: CHS-828(GMX1778)是一种竞争性的烟酰胺磷酸化转移酶抑制剂(NAMPT), IC₅₀ 值 <25 nM。CHS-828(GMX1778)通过降低细胞中的 NAD⁺水平发挥细胞毒性作用,具有较强的抗癌活性。

别名: GMX1778 (CHS828)

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 39mg/mL

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>98%

生物活性

产品描述	CHS-828(GMX1778) is a competitive inhibitor of nicotinamide phosphoribosyltransferase, with an IC ₅₀ less than 25 nM. CHS-828(GMX1778) exerts a cytotoxic effect by decreasing the cellular level of NAD ⁺ and exhibits a potent anticancer activity.
靶点	IC ₅₀ : <25 nM(NAMPT)
体外研究	CHS-828(GMX1778)通过提高超氧化物水平同时降低细胞内 NAD ⁺ 水平来增加癌细胞内的 ROS。值得注意的是, CHS-828(GMX1778)治疗不会在正常细胞中诱导 ROS。通过以 NA 磷酸核糖基转移酶 1(NAPRT1)依赖的方式添加烟酸(NA),可以降低 CHS-828(GMX1778)诱导的 ROS。
体内研究	在 NAPRT1 缺陷型异种移植实验中, 4 小时静脉输注 NA(120 mg/kg 体重)不会对 24 小时静脉输注 150 mg/kg 或 650 mg/kg 剂量的 CHS-828(GMX1778)的抗肿瘤活性产生不利影响。650 mg/kg 的 CHS-828 剂量高于最大耐受剂量。在接受 50 mg/kg CHS-828 治疗后立即进行 4 小时静脉输注 NA, 可降低与 GMX1777 毒性剂量相关的死亡率。

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。

储液配置



体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6892 mL	13.4459 mL	26.8918 mL
5 mM	0.5378 mL	2.6892 mL	5.3784 mL
10 mM	0.2689 mL	1.3446 mL	2.6892 mL

【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（如 0.22 μ m 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

- [1]. Watson M, et al. The small molecule GMX1778 is a potent inhibitor of NAD⁺ biosynthesis: strategy for enhanced therapy in nicotinic acid phosphoribosyltransferase 1-deficient tumors. Mol Cell Biol. 2009 Nov;29(21):5872-88.
- [2]. Cerna D, et al. Inhibition of nicotinamide phosphoribosyltransferase (NAMPT) activity by small molecule GMX1778 regulates reactive oxygen species (ROS)-mediated cytotoxicity in a p53- and nicotinic acid phosphoribosyltransferase1 (NAPRT1)-dependent manner. J Biol Chem. 2012 Jun 22;287(26):22408-17.

J260102

