

## GMX1778 ; CHS828

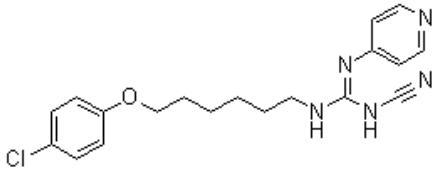
产品编号 : MB4257

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C19H22ClN5O	结 构 式	
分子量	371.86		
CAS No.	200484-11-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 74 mg/mL (198.99 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 :** GMX1778(CHS-828)是 NAMPT 高效抑制剂, 可抑制剂 NAD\_addition\_的生化合成。

**别名 :** GMX1778 ; Guanidine, N-[6-(4-chlorophenoxy)hexyl]-N'-cyano-N''-4-pyridinyl

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 74 mg/mL (198.99 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

<b>产品描述</b>	GMX1778 (CHS828) 是一种有效的特异性 nicotinamide phosphoribosyltransferase (NAMPT)抑制剂, IC50 和 K <sub>d</sub> 分别为 < 25 nM 和 120 nM。	
<b>靶点</b>	NAMPT  <25 nM	NAMPT  120 nM(K <sub>d</sub> )
<b>体外研究</b>	GMX1778 通过抑制 NAD <sup>+</sup> 生物合成诱导 NAD <sup>+</sup> 消耗, 随后导致 ATP 耗竭, 最终使细胞死亡。GMX1778 诱导程序性细胞死亡, 并伴随凋亡特征。GMX1778 通过下调 IKK 活性, 抑制癌症	

	细胞中核因子κB(IC50=8 nM)。
<b>体内研究</b>	在移植的裸鼠体内，GMX1778 (250 mg/kg, p.o.)对三种不同的人神经内分泌肿瘤，肠癌(GOT1)，胰腺癌(BON)，和甲状腺髓样癌(GOT2)表现出显著的抗肿瘤活性。

### 美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4256	STF-118804
MB4280	P7C3

**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。

GMX1778(CHS-828)是 NAMPT 高效抑制剂，本品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	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
50 mM	0.0538 mL	0.2689 mL	0.5378 mL

### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p>体外耦合酶 NAMPT 试验:</p> <p>重组 NAMPT 活性使用基于 NAD<sup>+</sup> 定量的耦合酶测定进行评估。反应在室温下使用包含 50 mM HEPES (pH 7.4), 50 mM KCl, 5 mM MgCl<sub>2</sub>, 0.5 mM β-巯基乙醇, 0.005% 牛血清白蛋白, 1% DMSO, 2.0 U/ml 乳酸脱氢酶, 4 mM L-乳酸钠, 0.4 U/ml 心肌黄酶, 6 μM 刃天青钠盐, 0.4 mM PRPP, 3.0 nM NMNAT1, 125 μM ATP, 50 μM NM, 和 2-5 μM 重组 NAMPT 的混合物进行 180 分钟。荧光性使用 Tecan Safire 酶标仪(激发波长 560 nm; 发射波长 590 nm)测量。Ki 值使用 Graphpad Prism 4.0 软件和 Cheng-Prusoff 方程计算。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> HeLa 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> ~100 nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 72 小时</p> <p><b>Method:</b> GMX1778 在 DMSO 中连续稀释以达到 0.2% DMSO 的终浓度。72 小时后，相对 ATP 水平使用 ViaLight HS 高灵敏度细胞毒性和细胞增殖生物测定试剂盒根据制造商指示测定。对于 GMX1778 细胞毒性挽救实验，细胞用 NA (10 μM)或 NMN (100 μM)处理，同时使用 GMX1778 处理。S 形剂量响应曲线使用 4.00 版 GraphPad Prism(GraphPad 软件) 通过可</p>

	变斜率的非线性回归分析生成，以计算 50%抑制(IC50)值。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 负荷中肠癌(GOT1)，胰腺癌(BON)和甲状腺髓样癌(GOT2)肿瘤的裸鼠 <b>Formulation:</b> 悬浮在含 2%羧甲基纤维素的 0.9%生理盐水中 <b>Dosages:</b> ~250 mg/kg <b>Administration:</b> 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(M2)	Km 系数
狻狻	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。