

## FK-866(AP-O866) ; FK866 (APO866)

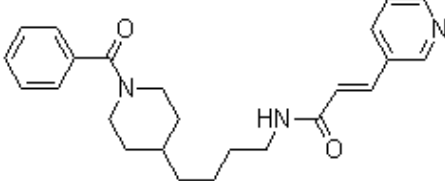
产品编号 : MB4304

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C24H29N3O2	结 构 式	
分子量	391.51		
CAS No.	658084-64-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : Insoluble Water : Insoluble Ethanol : 78 mg/mL (199.22 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 :** FK866 是烟酰胺磷酸核糖转移酶 (NMPRTase) 的有效抑制剂。

**别名 :** 达珀利奈 ; Daporinad; APO866 ; 2-Propenamide, N-[4-(1-benzoyl-4-piperidiny)butyl]-3-(3-pyridinyl)-, (2E)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至淡黄色固体

溶解性 : .....DMSO : Insoluble ; Water : Insoluble ; Ethanol : 78 mg/mL (199.22 mM)

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>	Daporinad (FK866, APO866)有效抑制烟酰胺磷酸核糖转移酶(NMPRTase), 无细胞试验中 IC50 为 0.09 nM。Phase 1/2。
<b>靶点</b>	NMPRTase (Cell-free assay) 0.4 nM(Ki)
<b>体外研究</b>	APO866 在 0.09-27 nM 的低浓度范围内会在 41 血液恶性肿瘤细胞中诱导产生细胞毒性, 包括急性髓细胞白血病[AML], 急性淋巴细胞白血病 [ALL], 套细胞淋巴瘤[MCL], 慢性淋巴细胞白血病[CLL]和 T 细胞淋巴瘤, 这种毒性具有剂量依赖特性. APO866 在 0-10 nM 的低浓度范

	围内会诱导细胞死亡，这一效果与线粒体膜去极化有关而与半胱天冬酶的激活无关。APO866 在 0-10 nM 的浓度范围内会诱导胞内 NAD 和 ATP 的损耗和多种血液肿瘤细胞的死亡，这一效果具有剂量依赖特性。10 nM APO866 会抑制 HFFF2 细胞内 PBEF 诱导的 MMP-3, CCL2 和 CXCL8 的分泌。
<b>体内研究</b>	用 C.B.-17 SCID 小鼠建立人急性髓细胞白血病，淋巴瘤细胞淋巴瘤和白血病的异种移植模型，腹腔注射 APO866，一天两次，一次 20 mg/kg 一周 4 天，重复三周以上可以抑制肿瘤生长。对于携带 CIA 的小鼠，0.12 mg/kg/小时剂量的 APO866 可以通过抑制 PBEF 来防止关节破坏和白细胞浸润。

**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。FK866 是烟酰胺磷酸核糖转移酶 (NMPRTase) 的有效抑制剂。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	2.5542 mL	12.7711 mL	25.5421 mL
5 mM	0.5108 mL	2.5542 mL	5.1084 mL
10 mM	0.2554 mL	1.2771 mL	2.5542 mL
50 mM	0.0511 mL	0.2554 mL	0.5108 mL

### 经典实验操作（仅供参考）

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 41 血液恶性肿瘤细胞系</p> <p><b>Concentrations:</b> 0 - 10 nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 72 小时或 96 小时</p> <p><b>Method:</b> MTT 分析流程, 细胞按每毫升 <math>0.5 \times 10^6</math> 个的密度接种到 96 孔板, 接种三份。将 APO866 (0.01 nM-100 nM) 加到 50 <math>\mu</math>L 培养基中, 空白培养基作为对照。孵育 72 或 96 小时后每孔加入 15 <math>\mu</math>L 染料溶液继续孵育 4 小时。然后每孔加入 100 <math>\mu</math>L 终止液孵育 1 小时, 用分光光度计测量 570 nm 处吸光度。台盼蓝染色分析流程, 细胞按每孔 <math>0.5 \times 10^5</math> 个接种到 6 孔板, 每孔加入 1 mL 培养基, 在含有或缺少 APO866 的情况下孵育 96 小时。每孔取 10 <math>\mu</math>L 细胞样品与 10 <math>\mu</math>L 台盼蓝孵育 1 分钟 (体积比 1:1)。细胞存活情况通过计算未染色的细胞个数来获得。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 人急性髓细胞白血病, 淋巴瘤以及白血病的 C.B.-17 SCID 小鼠异种移植模型</p> <p><b>Formulation:</b> 用 0.9% 生理盐水配制</p> <p><b>Dosages:</b> 20 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 腹腔注射一天两次, 连续四天, 重复 3 周以上</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。