

## NLG919 ; Navoximod ; IDO-IN-7

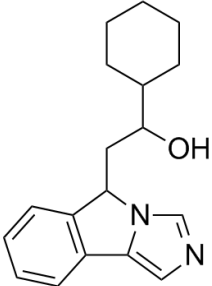
产品编号：MB5145

质量标准：>98%,IDO 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：白色至卡其色固体粉末

### 基本信息

分子式	C18H22N2O	结构式	
分子量	282.38		
CAS No.	1402836-58-1		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	Ethanol 30 mg/mL (106.23 mM) DMSO 15 mg/mL warmed (53.11 mM) Water 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：**NLG919 是一种新型的、可口服的吡啶胺 2,3-双加氧酶 (IDO) 途径的小分子抑制剂。Ki 和 EC50 值分别为 7 nM 和 75 nM。IDO 途径是参与过敏性炎症的重要通路，通过将色氨酸 (Trp) 代谢合成犬尿氨酸 (kynurenine) 介导免疫抑制效应，分别经由 GCN2、mTOR 和 AHR 诱导下游信号，从而影响 T 细胞的增值和分化。

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至卡其色固体粉末

纯度：.....>98%

溶解性：.....Ethanol 30 mg/mL (106.23 mM) ; DMSO15 mg/mL warmed (53.11 mM) ;

Water Insoluble

### 生物活性

<b>产品描述</b>	NLG919 是一种有效的 <b>IDO (indoleamine-(2,3)-dioxygenase)</b> 通路抑制剂，无细胞试验中 <b>K<sub>i</sub>/EC50</b> 为 7 nM/75 nM。		
<b>靶点</b>	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td>IDO (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>75 nM(EC50)</td> </tr> </table>	IDO (Cell-free assay)	75 nM(EC50)
IDO (Cell-free assay)			
75 nM(EC50)			
<b>体外研究</b>	NLG919 有效阻止 IDO 诱导的 T 细胞抑制和大量 T 细胞产生，ED50 为 80 nM。类似地，使用从肿瘤引流淋巴结得到表达 IDO 的小鼠 DC，NLG919 抑制 IDO 诱导的抗原特异性 T 细胞，ED50 为 120 nM。		
<b>体内研究</b>	在小鼠中，NLG919 单次口服给药降低血浆和组织 Kyn 浓度约 50%。在含 B16F10 瘤的小鼠中，NLG919 显著增强了 pmel-1 细胞接种同源 hgp100 肽和 CpG-1826 的抗肿瘤反应。		

**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。NLG919 是一种有效的

IDO (indoleamine-(2,3)-dioxygenase)通路抑制剂,无细胞试验中  $K_i/EC_{50}$  为 7 nM/75 nM。由于 IDO 途径与各种恶性肿瘤的既定相关性, NLG919 被用于与癌症相关的免疫抑制的治疗。

#### 储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		3.5413 mL	17.7066 mL	35.4133 mL
5 mM		0.7083 mL	3.5413 mL	7.0827 mL
10 mM		0.3541 mL	1.7707 mL	3.5413 mL
50 mM		0.0708 mL	0.3541 mL	0.7083 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验:	
细胞系	人和鼠 IDO+ pDCs
制备方法	溶解度有限。若配制更高浓度的溶液,一般步骤如下:请将试管置于 37°C 加热 10 分钟和/或将其置于超声波浴中震荡一段时间。原液于 -20°C 可放置数月。
反应条件	37°C
实验结果	NLG919 有效地阻断 IDO 诱导的 T 细胞抑制,恢复强有力的 T 细胞应答, $EC_{50}$ 为 90 nM。在来自小鼠肿瘤引流淋巴结的 IDO+ pDCs 中, NLG919 消除了体外 IDO 诱导的抗原特异性 T 细胞 (OT-I 或 pmel-1) 的抑制, $ED_{50}$ 为 130 nM。
动物实验:	
动物模型	携带 B16F10 肿瘤小鼠
给药剂量	NLG919 以 3 mg/mL 溶于水中给药,同时 IP 注射 6 mg 的日剂量或 1 mg/dose,每天两次,皮下注射,同时 SC 渗透泵注射 360 $\mu$ g/day。
实验结果	在同源 hgp100 肽加上 CpG-1826 接种的幼稚 pmel-1 细胞 IFA 中, NLG919 显著增强了抗肿瘤应答。NLG919 加 pmel-1/疫苗在接种的 4 天内,肿瘤大小显著减小。与接受 pmel-1/疫苗没有使用 NLG919 的对照动物相比,肿瘤体积减少约 95%。
注意事项	请于室内测试所有化合物的溶解度。虽然化合物的实际溶解度可能与其理论值略有不同,但仍处于实验系统误差的允许范围内。

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

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。