

NCB0846 ; NCB-0846

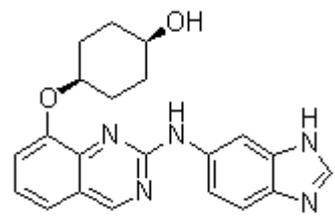
产品编号 : MB5300

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C21H21N5O2	结构式	
分子量	375.42		
CAS No.	1792999-26-8		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 75 mg/mL warmed (199.77 mM) Water : Insoluble Ethanol : 2 mg/mL warmed (5.32 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 : NCB-0846 是具有口服活性的 TNIK 抑制剂。

别名 : Cyclohexanol, 4-[[2-(1H-benzimidazol-6-ylamino)-8-quinazolinyloxy]-, cis

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 75 mg/mL warmed (199.77 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 2 mg/mL warmed (5.32 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	NCB-0846 是一种新型的、口服的 Wnt 小分子化合物抑制剂, 抑制 TNIK (TRAF2 and NCK-Interacting Kinase)的 IC50 为 21 nM。
靶点	TNIK (Cell-free assay) 21 nM
体外研究	NCB-0846 抑制 Wnt 信号, 具有抗肿瘤和抗 CSC 活性。NCB-0846 与处于非活性构象的 TNIK 结合, 抑制 TNIK 的 IC50 为 21 nM。它还能抑制 FLT3、JAK3、PDGFR α 、TRKA,

	<p>CDK2/CycA2, 和 HGK(>80% at 0.1 μM)。NCB-0846 在 0.1-0.3 μM 的浓度范围内, 诱导 TNIK 磷酸化的 TCF 加快迁移; 并在浓度为 3 μM 时, 抑制 TCF4 的磷酸化。此外, NCB-0846 可抑制 TNIK 的自我磷酸化。在 Wnt3a 处理过的 HEK293、HCT116(携带 CTNNB1 突变)、DLD-1 (携带 APC 突变) 结直肠癌细胞中, NCB-0846 抑制 TCF/LEF 的转录活性。NCB-0846 减少 Wnt 靶基因 AXIN2 和 MYC 的表达以及 TNIK 靶基因表达, 而不影响 CCND1 的表达。NCB-0846 还可在蛋白水平上降低 TNIK、AXIN2 和 cMYC 的表达。LRP6 和 LRP5 也受到 NCB-0846 的影响而下调。在体外, NCB-0846 抑制癌细胞生长, 使处于 sub-G1 期的细胞数量增多。它可下调一些假定的结肠直肠 CSC 标记的表达, 如 CD44、CD133 和 ALDH1, 减少高表达 CSC 表面标记 (CD44, CD133, CD166, CD29 和 EpCAM) 的细胞数目。NCB-0846 还可减少间充质标记的表达 (lug, Snail, Twist, Smad2 和 Vimentin)。然而, 胚胎干细胞标记如 Oct4, Nanog 和 Sox2 没有被影响。</p>
体内研究	<p>在 Apcmin/+ 小鼠中, NCB-0846 抑制 Wnt 信号驱动的肠道肿瘤发生, 并抑制结肠直肠癌细胞的克隆球形成和肿瘤形成活性。小鼠 (免疫缺陷的异种移植瘤模型) 的体重在处理以 NCB-0846 后下降, 但会逐渐恢复。Wnt 靶基因 (AXIN2, MYC 和 CCND1) 在异种移植瘤中的表达也减少, NCB-0846 可剂量依赖性降低小肠肿瘤的尺寸和多样性, 显著地移植 PDXs (patient-derived xenografts) 的生长</p>

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)

MB4053	KY02111
MB4597	Wnt Agonist 1
MB4051	Wnt-C59 (C59)

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。NCB-0846 是具有口服活性的 TNIK 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	2.6637 mL	13.3184 mL	26.6368 mL
5 mM	0.5327 mL	2.6637 mL	5.3274 mL
10 mM	0.2664 mL	1.3318 mL	2.6637 mL
50 mM	0.0533 mL	0.2664 mL	0.5327 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: HCT116 细胞 Concentrations: 1 μM Incubation Time: 4 或 24 h Method: 将 HCT116 细胞分别用 DMSO(对照组)、1 μM NCB-0846 或 1 μM NCB-0970 处理 4 或 24 小时, 然后提取其蛋白质进行免疫印迹分析。</p>
-------------	--

动物实验	Animal Models: 免疫缺陷小鼠 (遗传背景: BALB/c 裸鼠) Formulation: DMSO/polyethylene glycol#400/30% 2-hydroxypropyl-β-cyclodextrin solution (10:45:45, v/v) Dosages: 40 或 80 mg/kg BID Administration: 口服填喂法
-------------	---

【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(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。