

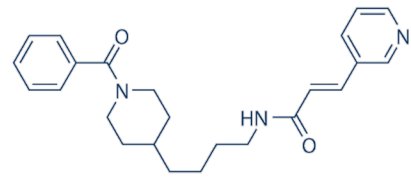
FK866 (Transferase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7257-10mM	FK866 (Transferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7257-5mg	FK866 (Transferase抑制剂)	5mg
SD7257-25mg	FK866 (Transferase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(E)-N-[4-(1-benzoylpiperidin-4-yl)butyl]-3-pyridin-3-ylprop-2-enamide
简称	FK866
别名	APO 866, APO-866, APO866, FK 866, FK-866, FK866 cpd
中文名	N/A
化学式	C ₂₄ H ₂₉ N ₃ O ₂
分子量	391.51
CAS号	658084-64-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 10mg/ml; Ethanol 78mg/ml
溶液配制	5mg加入1.28ml DMSO, 或每3.92mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7257-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	FK866 (APO866, Daporinad)有效抑制烟酰胺磷酸核糖转移酶(NMPRTase), 无细胞试验中IC50为0.09nM。Phase 1/2。				
信号通路	Metabolism				
靶点	NMPRTase	—	—	—	—
IC50	0.09nM	—	—	—	—
体外研究	APO866在0.09-27nM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0-10nM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0-10nM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。10nM APO866会抑制HFFF2细胞内PBEF诱导的MMP-3、CCL2和CXCL8的分泌。				
体内研究	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20mg/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, 0.12mg/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。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	41血液恶性肿瘤细胞系
浓度	0-10nM
处理时间	72小时或96小时
方法	MTT分析流程, 细胞按每毫升0.5×10 ⁶ 个的密度接种到96孔板, 接种三份。将APO866(0.01nM-100nM)加到50μl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15μl染料溶液继续孵育4小时。然后每孔加入100μl终止液孵育1小时, 用分光光度计测量570nm处吸光度。台盼蓝染色分析流程, 细胞按

	每孔 0.5×10^5 个接种到6孔板，每孔加入1ml培养基，在含有或缺少APO866的情况下孵育96小时。每孔取10 μ l细胞样品与10 μ 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。
--	---

动物实验	
动物模型	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
配制	用0.9%生理盐水配制
剂量	20mg/kg
给药方式	腹腔注射一天两次，连续四天，重复3周以上

➤ **参考文献:**

- 1.Nahimana A, et al. Blood, 2009, 113(14), 3276-3286.
- 2.Evans L, et al. Arthritis Rheum, 2011, 63(7), 1866-1877.
- 3.Olesen UH, et al. Mol Cancer Ther, 2010, 9(6), 1609-1617.
- 4.Zoppoli G, et al. Exp Hematol, 2010, 38(11), 979-988.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD7257-10mM	FK866 (Transferase抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SD7257-5mg	FK866 (Transferase抑制剂)	5mg
SD7257-25mg	FK866 (Transferase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01