



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: JBSNF-000088
CAS 号: 7150-23-4
产品货号: S87621

生物活性:		
Description	JBSNF-000088 (6-Methoxynicotinamide) 是烟酰胺 (NA) 的类似物, 是一种口服有效的 NNMT (烟酰胺 N-甲基转移酶) 抑制剂, 对人 NNMT, 猴 NNMT 和小鼠 NNMT 的 IC50 分别为 1.8 μM, 2.8 μM 和 5.0 μM。在代谢性疾病的动物模型中, JBSNF-000088 抑制 NNMT 活性, 降低 MNA 水平并驱动胰岛素增敏, 调节葡萄糖和减轻体重[1]。	
IC50 & Target	IC50: 1.8 μM (human NNMT), 2.8 μM (monkey NNMT) and 5.0 μM (mouse NNMT)[1]	
In Vitro	JBSNF-000088 (6-甲氧基烟酰胺) 对 U2OS 或分化的 3T3L1 细胞的 IC50 值为 1.6 μM 和 6.3 μM[1]。	
In Vivo	JBSNF-000088 (6-甲氧基烟酰胺) (50 mg/kg; 口服给药途径 4 周) 在第 21 天表现出具有统计学意义的体重 (%) 降低并导致进食血糖显著降低[1]。	
	JBSNF-000088 (50 mg/kg; 口服强饲法; 每天两次, 持续 4 周) 在第 28 天导致口服葡萄糖耐量显著改善, 葡萄糖耐量正常化[1]。	
	JBSNF-000088 (1 mg/kg; 静脉内给药; 持续 4 小时) 导致 21 mL/min •kg 的低血浆清除率和 0.7 L/kg 的稳态分布容积, 非常短的血浆静脉内给药后的半衰期 (0.5 小时)[1]。	
	JBSNF-000088 (10 mg/kg; 口服灌胃; 持续 4 小时) 导致 Cmax 为 3568 ng/mL, Tmax 值为 0.5 小时, 表明在体内快速吸收肠道, 口服灌胃的半衰期为 0.4 小时。发现口服生物利用度约为 40%[1]。	
	Animal Model:	Mice with high fat diet (HFD)-induced obesity[1]
	Dosage:	50 mg/kg
	Administration:	Oral route of administration for four weeks; oral gavage administration and twice daily for four weeks
	Result:	Showed statistically significant reduction in body weight (%) and led to a statistically significant reduction in fed blood glucose on day 21 by oral route of administration. Led to a statistically significant improvement in oral glucose tolerance on day 28 with glucose tolerance being normalized by oral gavage administration.
	Animal Model:	C57BL/6 mice[1]
	Dosage:	1 mg/kg (Intravenous administration);10 mg/kg (oral gavage)(Pharmacokinetic Study)
Administration:	Intravenous administration and oral gavage; for 4 hours	
Result:	Resulted in low plasma clearance of 21 mL/min•kg and the volume of distribution at steady state of 0.7 L/kg, a very short plasma half-life of 0.5 h upon intravenous administration. Resulted in a Cmax of 3568 ng/mL with a Tmax value of 0.5 hours, indicating rapid absorption in the intestine, and half-life of 0.4 hours by oral gavage.	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (657.23 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)	



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	Concentration				
	1 mM		6.5723 mL	32.8617 mL	65.7233 mL
	5 mM		1.3145 mL	6.5723 mL	13.1447 mL
	10 mM		0.6572 mL	3.2862 mL	6.5723 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 动物实验： 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (8.22 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (8.22 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (8.22 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。					
参考文献	[1]. Kannt A, et al. A small molecule inhibitor of Nicotinamide N-methyltransferase for the treatment of metabolic disorders. Sci Rep. 2018 Feb 26;8(1):3660.				
完整储备液配制表： 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。 -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	浓度				
DMSO	1 mM	6.5723 mL	32.8617 mL	65.7233 mL	164.3083 mL
	5 mM	1.3145 mL	6.5723 mL	13.1447 mL	32.8617 mL
	10 mM	0.6572 mL	3.2862 mL	6.5723 mL	16.4308 mL
	15 mM	0.4382 mL	2.1908 mL	4.3816 mL	10.9539 mL
	20 mM	0.3286 mL	1.6431 mL	3.2862 mL	8.2154 mL
	25 mM	0.2629 mL	1.3145 mL	2.6289 mL	6.5723 mL
	30 mM	0.2191 mL	1.0954 mL	2.1908 mL	5.4769 mL
	40 mM	0.1643 mL	0.8215 mL	1.6431 mL	4.1077 mL
	50 mM	0.1314 mL	0.6572 mL	1.3145 mL	3.2862 mL
	60 mM	0.1095 mL	0.5477 mL	1.0954 mL	2.7385 mL
	80 mM	0.0822 mL	0.4108 mL	0.8215 mL	2.0539 mL
	100 mM	0.0657 mL	0.3286 mL	0.6572 mL	1.6431 mL

