



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: **NCT503**
CAS 号: **1916571-90-8**
产品货号: **S88534**

生物活性:				
Description	NCT-503 磷酸甘油酸脱氢酶 (PHGDH) 抑制剂, IC50 值为 2.5 μ M。			
IC50 & Target	IC50: 2.5 μ M (PHGDH)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	MDA-MB-231	IC ₅₀	8 μ M	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells overexpressing PHGDH assessed as reduction in cell growth
	MDA-MB-468	EC ₅₀	8 μ M	Cytotoxicity against human MDA-MB-468 cells
In Vitro	NCT-503 是一种 PHGDH 抑制剂, 可抑制细胞中 3-磷酸甘油酸的丝氨酸合成 (IC ₅₀ =2.5 μ M)。NCT-503 对一组其他脱氢酶没有活性, 并且在 168 个 GPCR 中显示出最小的交叉反应性。NCT-503 与 3-磷酸甘油酸 (3-PG) 和共底物 NAD ⁺ 的竞争研究揭示了对 3-PG 和 NAD ⁺ 的非竞争性抑制模式。NCT-503 对 PHGDH 依赖性细胞系的 EC ₅₀ 为 8-16 μ M, 对 MDA-MB-231 的 EC ₅₀ 高 6 至 10 倍细胞, 并且对其他 PHGDH 非依赖性细胞系无毒性[1]。			
In Vivo	NCT-503 具有良好的吸收、分布、代谢和排泄 (ADME) 特性。NCT-503 在腹腔内给药后具有良好的暴露、半衰期 (2.5 小时) 和 C _{max} (血浆中 20 μ M), 并显著分配到肝脏和大脑中。NCT-503 处理可降低 PHGDH 依赖性 MDA-MB-468 异种植物的生长和重量, 但不影响 PHGDH 非依赖性 MDA-MB-231 异种植物的生长或重量[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (122.41 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) Ethanol 中的溶解度 : 13.33 mg/mL (32.63 mM; 超声助溶 (<60°C))			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.4481 mL	12.2405 mL
		5 mM	0.4896 mL	2.4481 mL
		10 mM	0.2448 mL	1.2241 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°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。 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: 2.5 mg/mL (6.12 mM); 悬浊液; 超声助溶			



	此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: 50% PEG300 $\rightarrow$ 50% Saline Solubility: 10 mg/mL (24.48 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: 0.5% Methylcellulose/0.2% Tween-80 in Saline water Solubility: 2 mg/mL (4.90 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Pacold ME, et al. A PHGDH inhibitor reveals coordination of serine synthesis and one-carbon unit fate. Nat Chem Biol. 2016 Jun;12(6):452-8.

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。

储备液的保存方式和期限: -80 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ 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
Ethanol / DMSO	1 mM	2.4481 mL	12.2405 mL	24.4810 mL	61.2025 mL
	5 mM	0.4896 mL	2.4481 mL	4.8962 mL	12.2405 mL
	10 mM	0.2448 mL	1.2241 mL	2.4481 mL	6.1203 mL
	15 mM	0.1632 mL	0.8160 mL	1.6321 mL	4.0802 mL
	20 mM	0.1224 mL	0.6120 mL	1.2241 mL	3.0601 mL
	25 mM	0.0979 mL	0.4896 mL	0.9792 mL	2.4481 mL
	30 mM	0.0816 mL	0.4080 mL	0.8160 mL	2.0401 mL



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

DMSO	40 mM	0.0612 mL	0.3060 mL	0.6120 mL	1.5301 mL
	50 mM	0.0490 mL	0.2448 mL	0.4896 mL	1.2241 mL
	60 mM	0.0408 mL	0.2040 mL	0.4080 mL	1.0200 mL
	80 mM	0.0306 mL	0.1530 mL	0.3060 mL	0.7650 mL
	100 mM	0.0245 mL	0.1224 mL	0.2448 mL	0.6120 mL



源叶