

产品名称: N-[2-[2-(2-氨基乙氧基)乙氧基]乙基]-4-[[4-[(环己基甲基)氨基]-6-[[[(4-氟苯基)甲基]氨基]-1,3,5-三嗪-2-基]氨基]苯乙酰胺
产品别名: AP-III-a4; ENOblock

生物活性:

Description	AP-III-a4 (ENOblock)是第一个 enolase 的非基底类似物抑制剂, IC50 为 0.576 μM 。				
IC ₅₀ & Target	enolase [1] (Cell-free assay)				
	0.576 μM				
In Vitro	HCT116 细胞中, AP-III-a4 在缺氧情况下诱导细胞死亡, 并通过下调 AKT 和 Bcl-xL 表达, 抑制癌细胞迁移和侵袭。在 Huh7 肝细胞和 HEK 肾脏细胞中, AP-III-a4 诱导葡萄糖摄取, 并抑制磷酸烯醇丙酮酸羧激酶 (PEPCK)表达。[1]				
In Vivo	在 HCT116 异种移植的斑马鱼肿瘤移植模型中, AP-III-a4 (10 μM)抑制癌细胞迁移和侵袭过程。在体内, AP-III-a4 (10 μM)也会引起 PEPCK 表达的下调和葡萄糖摄取的诱导, 并抑制脂肪生成和泡沫细胞形成。[1]				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 100 mg/mL (158.43 mM) Ethanol : 100 mg/mL (158.43 mM) Water : 9 mg/mL (14.25 mM)				
	Preparing Stock Solutions	<div>SolventMassConcentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.5843 mL	7.9217 mL	15.8433 mL
		5 mM	0.3169 mL	1.5843 mL	3.1687 mL
		10 mM	0.1584 mL	0.7922 mL	1.5843 mL
		50 mM	0.0317 mL	0.1584 mL	0.3169 mL
<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。</p>					
References	[1] Jung DW, et al. ACS Chem Biol. 2013, 8(6), 1271-1282.				

实验参考:

Cell Assay	细胞实验: [1] Cell lines: HCT116 细胞 Concentrations: 5 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 3 x 10 ⁵ HCT116 细胞接种到 6 孔板。24 小时后, 细胞用化合物每种重复三个孔处理(低氧诱导 4 小时, 或未诱导)24 小时。然后将细胞胰蛋白酶化, 并悬浮在 2.5 mL PBS 中。取 100 μL 等份试样用于 0.2% 台盼蓝溶液染色, 并使用血细胞计数器计数。计数 150 细胞, 死细胞不会被台盼蓝着色从而被排除。
	动物实验: [1] Animal Models: HCT116-异种移植的斑马鱼肿瘤异种移植模型 Formulation: DMSO Dosages: 10 μM Administration: --

Kinase Assay	<p>烯醇酶活性试验: [1]</p> <p>单个单位的烯醇被定义为标准试验中每分钟磷酸-D-甘油酸盐产生 1 μmol 磷酸烯醇丙酮酸的酶数量。</p> <p>37°C 下, 在包含 50 mM 盐酸咪唑(pH 6.8), 2.0 mM MgSO_4 和 400 mM KCl 的缓冲液中, ENOblock 或 NaF 存在或不存在下培育纯净烯醇酶(3–9 U)以测量烯醇酶活性。反应通过加入 1 μmol 2-磷酸-D-甘油酸盐起始, 反应时间 10 分钟后, 用分光光度计在 240 nm 下测量 OD。</p>
References	<p>[1] Jung DW, et al. ACS Chem Biol. 2013, 8(6), 1271-1282.</p>



源叶生物