

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 。																							
IC₅₀ & 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)																							
	<table border="1"> <thead> <tr> <th rowspan="2">Preparing</th> <th>Solvent Mass</th> <th rowspan="2">1 mg</th> <th rowspan="2">5 mg</th> <th rowspan="2">10 mg</th> </tr> <tr> <th>Concentration</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="4">Stock Solutions</td> <td>1 mM</td> <td>1.5843 mL</td> <td>7.9217 mL</td> <td>15.8433 mL</td> </tr> <tr> <td>5 mM</td> <td>0.3169 mL</td> <td>1.5843 mL</td> <td>3.1687 mL</td> </tr> <tr> <td>10 mM</td> <td>0.1584 mL</td> <td>0.7922 mL</td> <td>1.5843 mL</td> </tr> <tr> <td>50 mM</td> <td>0.0317 mL</td> <td>0.1584 mL</td> <td>0.3169 mL</td> </tr> </tbody> </table>	Preparing	Solvent Mass	1 mg	5 mg	10 mg	Concentration	Stock Solutions	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
	Preparing		Solvent Mass				1 mg		5 mg	10 mg														
		Concentration																						
	Stock Solutions	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																				
*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, 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。																								
References	[1] Jung DW, et al. ACS Chem Biol. 2013, 8(6), 1271-1282.																							
实验参考:																								
Cell Assay	<p>细胞实验: [1]</p> <p>Cell lines: HCT116 细胞</p> <p>Concentrations: 5 μM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method:</p> <p>3 x 10⁵ 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。</p>																							
Animal Administration	<p>动物实验: [1]</p> <p>Animal Models: HCT116-异种移植的斑马鱼肿瘤异种移植模型</p> <p>Formulation: DMSO</p> <p>Dosages: 10 μM</p> <p>Administration: --</p>																							

Kinase Assay	烯醇酶活性试验: [1] 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。 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。
References	[1] Jung DW, et al. ACS Chem Biol. 2013, 8(6), 1271-1282.



源叶生物