

## AZD1080

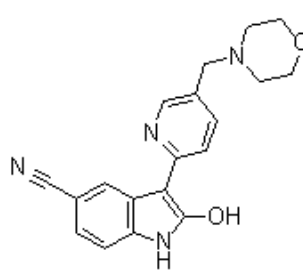
产品编号：MB3724

质量标准：>98%，GSK3 抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：粉状

### 基本信息

分子式	C19H18N4O2	结 构 式	
分子量	334.37		
CAS No.	612487-72-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 52 mg/mL (155.51 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介：** AZD1080 是一种有效的选择性 GSK3 抑制剂。AZD1080 抑制重组人 GSK3 $\alpha$  和 GSK3 $\beta$ 。

**别名：** HY-13862; AZD-1080; AZD 1080;

2-Hydroxy-3-[5-[(morpholin-4-yl)methyl]pyridin-2-yl]-1H-indole-5-carbonitrile

### 物理性状及指标：

外观：.....浅黄色至橙色粉末

溶解性：.....DMSO : 52 mg/mL (155.51 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：** -20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	AZD1080 是一种口服生物有效的，选择性的，可透过大脑的 GSK3 抑制剂，抑制人类 GSK3 $\alpha$ 和 GSK3 $\beta$ ， $K_i$ 分别为 6.9 nM 和 31 nM，比作用于 CDK2，CDK5，CDK1 和 Erk2 选择性高 14 倍以上。	
<b>特性</b>	A brain permeable GSK3 inhibitor.	
<b>靶点</b>	GSK-3 $\alpha$	GSK-3 $\beta$

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	6.9 nM	31 nM
<b>体外研究</b>	AZD1080 是一种选择性，有口服活性，脑渗透性的 GSK3 抑制剂，抑制人 GSK3 $\alpha$ 和 GSK3 $\beta$ ， $K_i$ 值分别为 6.9 nM 和 31 nM，显示对 CDK2，CDK5，CDK1 和 ERK2 >14 倍的选择性。在表达人类 tau 蛋白的细胞中，AZD1080 抑制 tau 蛋白磷酸化，IC <sub>50</sub> 为 324 nM。	
<b>体内研究</b>	口服 AZD1080 抑制大鼠脑中 tau 蛋白磷酸化，用脑/血浆浓度比在最高浓度时达到 0.5-0.8。在小鼠中，AZD1080 逆转认知缺陷和挽救突触功能障碍。急性口服 AZD1080 抑制外围 GSK3 的活性，产生了剂量依赖性降低磷酸化糖原合成酶和总糖原合成酶（GS）的比率，在最高剂量（10 微摩尔/千克）时达到平均最大抑制效果 49%。	

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB4289	AR-A014418
MB4519	BIO-acetoxime
MB3793	GSK343
MB3813	GSK3787

**用途及描述**：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。AZD1080 是一种有效的选择性 GSK3 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.9907 mL	14.9535 mL	29.9070 mL
5 mM	0.5981 mL	2.9907 mL	5.9814 mL
10 mM	0.2991 mL	1.4953 mL	2.9907 mL
50 mM	0.0598 mL	0.2991 mL	0.5981 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验：</b>	<p>激酶检测:</p> <p>GSK3 的闪烁亲近测定法进行。在透明底的微量滴定板中进行竞争实验，复孔加入 10 个浓度梯度的抑制剂。生物素化的肽底物生物素- AAEELDSRAGS ( PO 3 H 2 ) PQL 加入检测缓冲液中达到终浓度 2 <math>\mu</math>M，检测缓冲液含有 6 毫单位的重组人 GSK3 ( <math>\alpha</math>和<math>\beta</math>的等量混</p>
--------------	---

	<p>合), 12mM 的 MOPS, pH 为 7.0, 0.3 mM 的 EDTA, 0.01% β-巯基乙醇, 0.004 % 的 Brij 35, 0.5 % 甘油, 和 0.5 微克牛血清 albumin/25 微升, 预热 10-15 分钟。该反应通过在 50mM 醋酸镁中加入 0.04 μCi [γ-33P]ATP 和未标记的 ATP 至终浓度 1μM 和终体积 25 微升而起始。空白对照没有加入多肽底物。在室温孵育 20 分钟后, 每个反应通过加入 25 微升含有 5 mM EDTA, 50 μM ATP, 0.1 % 的 Triton X -100, 和 0.25 mg 的链霉抗-涂覆的 SPA 而终止。6 小时后放射活性在液体闪烁计数器测定。</p>
<p><b>细胞实验 :</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> 稳定表达 4 重复人 tau 的 3T3 成纤维细胞  <b>Concentrations:</b> ~20mM  <b>Incubation Time:</b> 0-8 小时  <b>Method:</b> 3T3 成纤维细胞通过基因工程手段稳定表达四个重复 tau 蛋白。这些细胞具有 GSK3β 的高内源性水平, 能够组成性磷酸化 tau 蛋白。这种磷酸化可通过氯化锂抑制。用不同的化合物处理后, 培养物用 5mM 的氯化镁-PBS 洗涤两次。提取物进行 Western 印迹分析通过在冰冷的提取缓冲液制备均质化细胞 (20 mM HEPES, pH 值 7.4, 100mM 的氯化钠, 10mM 的氟化钠, 1% 的 Triton X- 100, 1 mM 的原钒酸钠, 10mM EDTA, 蛋白酶抑制剂 (2 mM 苯甲磺酰氟, 10 微克/毫升抑肽酶, 10 微克/毫升亮肽素, 和 10 μg/ ml 的胃蛋白酶抑制剂)。将样品在 4°C 匀浆, 通过 Bradford 法测定蛋白质含量。总蛋白 (25 微克) 在 10%SDS -PAGE 凝胶上进行电泳, 并转移到硝酸纤维素膜上。本实验用下列一抗进行: tau 蛋白丝氨酸 (P) -396, 1:1000; Tau5, 1:1000; 和抗 GSK3β, 1:1000。该过滤器是在 5% 脱脂奶粉孵育的抗体 4°C 孵育过夜。将第二抗体 (1:5000) 在加入 ECL 检测试剂用于免疫检测。免疫反应的定量是通过光密度扫描完成。</p>
<p><b>动物实验 :</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> C57BL/6 小鼠  <b>Formulation:</b> 0.5% 抗坏血酸, 0.01% EDTA, pH 2.0 的水溶液  <b>Dosages:</b> 3 or 10 μmol/kg, 6 mL/kg  <b>Administration:</b> 口服灌胃</p>

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

**活性化合物操作注意事项**

**1 产品分装:** 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

**2 储备液制备:** 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表  
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。