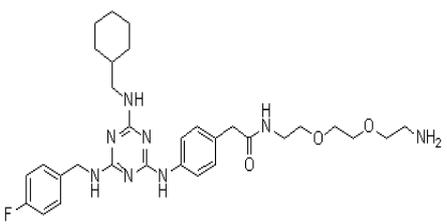


## AP-III-a4 (ENOblock); AP-III-a4

产品编号: MB4691  
质量标准: >98%,BR  
包装规格: 5MG;25MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C31H43FN8O3	结 构 式	
分子量	631.18		
CAS No.	1177827-73-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (158.43 mM) Water: 9 mg/mL (14.25 mM) Ethanol: 100 mg/mL (158.43 mM)		
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:** ENOblock(AP-III-a4)是第一个非底物类似物, 可直接与烯醇酶结合, 能抑制体内癌细胞转移。

**别名:** ENOblock; N-[2-[2-(2-aminoethoxy)ethoxy]ethyl]-4-[[4-[(cyclohexylmethyl)amino]-6-[[4-(4-fluorophenyl)methyl]amino]-1,3,5-triazin-2-yl]amino]-benzeneacetamide hydrochloride

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO : 100 mg/mL (158.43 mM); Water: 9 mg/mL (14.25 mM); Ethanol: 100 mg/mL (158.43 mM)

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>	AP-III-a4 (ENOblock)是第一个 enolase 的非基底类似物抑制剂, IC50 为 0.576 μM。
<b>靶点</b>	enolase(Cell-free assay) 0.576 μM
<b>体外研究</b>	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。
<b>体内研究</b>	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。

**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。ENOblock(AP-III-a4)是第一个非底物类似物, 可直接与烯醇酶结合, 能抑制体内癌细胞转移。本品可用于相关领域的科研实验。

### 储液配置

体 积 浓度	质 量 积	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

### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p><b>烯醇酶活性试验:</b> 单个单位的烯醇酶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<sub>4</sub> 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>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> HCT116 细胞 <b>Concentrations:</b> 5 μM <b>Incubation Time:</b> 24 小时 <b>Method:</b> 3 x 10<sup>5</sup> 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>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> HCT116-异种移植的斑马鱼肿瘤异种移植模型 <b>Formulation:</b> DMSO <b>Dosages:</b> 10 μM <b>Administration:</b> --</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。