

AS1842856

产品信息

| 产品名称 | 产品编号 | 规格 |
|-----------|-----------|-------|
| AS1842856 | 53540ES08 | 5 mg |
| | 53540ES25 | 25 mg |

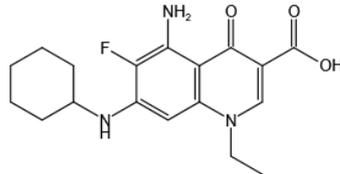
产品描述

AS1842856 (AS-1842856)是一种特异性的 Foxo1 抑制剂, IC₅₀ 为 33 nM, 具有细胞通透性。AS1842856 通过与活化的 FoxO1 直接结合而抑制其介导的反式激活, 但不影响 FoxO1 自身的转录和蛋白质表达。AS1842856 不结合 Ser256 位磷酸化的 Foxo1。Foxo1 是胰腺β细胞团的关键调控因子, 调节胰岛素对肝糖异生的影响。

产品性质

| | |
|------------------------|---------------------------------------------------------------|
| 英文别名 (English Synonym) | AS1842856, AS-1842856 |
| 靶点 (Target) | Foxo1 |
| 通路 (Pathway) | Autophagy |
| CAS 号 (CAS NO.) | 836620-48-5 |
| 分子式 (Formula) | C ₁₈ H ₂₂ N ₃ O ₃ |
| 分子量 (Molecular Weight) | 347.38 |
| 外观 (Appearance) | 粉末 |
| 纯度 (Purity) | ≥98% |
| 溶解性 (Solubility) | 溶于 DMSO |

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

在瞬时转染 Foxo1 表达载体的 HepG2 细胞中, AS1842856 有效地抑制了 Foxo1 介导的启动子活性。0.1 μ M AS1842856 分别抑制了 3% Foxo3a 和 20% Foxo4 介导的启动子活性, 但 Foxo1 介导的启动子活性降低了 70%。AS1842856 可能通过降低 G6Pase 和 PEPCK 的 mRNA 水平, 抑制内源性 G6Pase 和 PEPCK 活性, 这可能抑制 Fao 细胞中葡萄糖的生成。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

在糖尿病 db/db 突变小鼠中, 口服 AS1842856 (100 mg/kg), 通过抑制肝脏糖异生相关基因, 导致空腹血糖值大幅度下降。正常小鼠口服 AS1842856 后则无此影响。AS1842856 还会抑制由于注射丙酮酸酯 (正常小鼠以及 db/db 小鼠) 所引起的血糖水平的上升。^[1]

参考文献

- [1]. Nagashima T, et al. Discovery of novel forkhead box O1 inhibitors for treating type 2 diabetes: improvement of fasting glycemia in diabetic db/db mice. *Mol Pharmacol.* 2010 Nov;78(5):961-70.
- [2]. He J, et al. The resistant effect of SIRT1 in oxidative stress-induced senescence of rat nucleus pulposus cell is regulated by Akt-FoxO1 pathway. *Biosci Rep.* 2019 May 10;39(5): BSR20190112.