

AZD1080

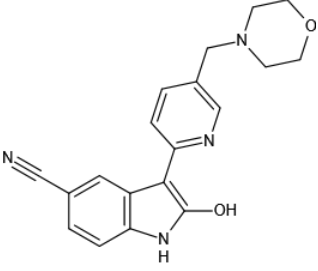
产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52990ES08	5 mg
AZD1080	52990ES10	10 mg
	52990ES50	50 mg

产品描述

AZD1080 是有效的、口服的、可选择性透过大脑的 GSK3 抑制剂。AZD1080 通过与 ATP 口袋结合来抑制 GSK3 β ，作用于重组人 GSK3 α/β 的 K_i 值为 6.9 nM 和 31 nM。AZD1080 还能抑制 tau 蛋白的磷酸化， IC_{50} 值为 324 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AZD1080; AZD 1080
中文名称 (Chinese Name)	2-羟基-3-[5-[(吗啉-4-基)甲基]吡啶-2-基]-1H-吲哚-5-甲腈
靶点 (Target)	GSK-3 α , GSK-3 β
CAS 号 (CAS NO.)	612487-72-6
分子式 (Formula)	C ₁₉ H ₁₈ N ₄ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	334.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO，不溶于水和酒精
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C，有效期 2 年。建议分装后-20°C避光保存，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）

AZD1080 处理稳定表达 4-repeat human tau 蛋白的 3T3 成纤维细胞，AZD1080 以浓度依赖性方式抑制人 tau 蛋白的磷酸化。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

年轻雄性和雌性 Sprague-Dawley 大鼠（11-12 天大）口服 3 或 10 $\mu\text{mol/kg}$ 的 AZD1080，在 AZD1080 给药 6 h 后，大鼠海马中 tau 磷酸化(P-Thr231)的最大抑制作用为 $38 \pm 2\%$ 和 $48 \pm 2\%$ 。在小鼠认知模型中，雄性 C57BL/6 小鼠（8-12 周龄）口服 4 或 15 $\mu\text{mol/kg}$ 的 AZD1080，每天两次，持续三天，显著逆转了 MK-801 诱导的认知缺陷。^[1] 此外，在帕金森(PD)小鼠模型中，C57BL/6 小鼠口服 20 mg/kg 的 AZD1080，抑制 p-Tau 和 p-GSK3 β 的表达，并改善 PD 小鼠 MPTP 模型中神经变性和运动功能障碍。^[2]

参考文献

- [1]. Georgievska B, et al. AZD1080, a novel GSK3 inhibitor, rescues synaptic plasticity deficits in rodent brain and exhibits peripheral target engagement in humans. *J Neurochem.* 2013;125(3):446-56.
- [2]. Hu S, et al. Phosphorylation of Tau and α -Synuclein Induced Neurodegeneration in MPTP Mouse Model of Parkinson's Disease. *Neuropsychiatric Disease and Treatment.* 2020;16:651.