

# 1-Azakenpaullone

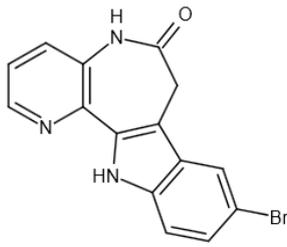
## 产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52972ES05	2 mg
1-Azakenpaullone	52972ES08	5 mg
	52972ES10	10 mg

## 产品描述

1-Azakenpaullone 是高效的、细胞渗透性和 ATP 竞争性的糖原合酶激酶-3 $\beta$  (GSK-3 $\beta$ )抑制剂 (IC<sub>50</sub> 值为 18 nM), 并且对 GSK-3 $\beta$  的抑制效果是 CDK1 和 CDK5 的 100 倍以上。同时, 1-Azakenpaullone 可应用于抗糖尿病药物的开发。

## 产品性质

英文别名 (English Synonym)	1-AKP; 1AKP; Kinome_3492; Kinome3492; HMS3229B07; azakenpaullone; 1Azakenpaullone; Azakenpaullone
中文名称 (Chinese Name)	1-氮杂坎帕罗酮
靶点 (Target)	GSK-3 $\beta$
CAS 号 (CAS NO.)	676596-65-9
分子式 (Formula)	C <sub>15</sub> H <sub>10</sub> BrN <sub>3</sub> O
分子量 (Molecular Weight)	328.16
外观 (Appearance)	固体粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥10 mg/mL, 不溶于水和乙醇
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）

为了检测 1-Azakenpaullone 对 GSK-3 的抑制作用，用 30  $\mu\text{M}$  1-Azakenpaullone 工作液和 20 nM 雷帕霉素分别孵育雷帕霉素耐药的乳腺癌细胞系 HCC1806 不同时长（0~24 h）后，计数细胞。发现 1-Azakenpaullone 可以有效抑制细胞生长，这与 GSK-3 促进细胞增殖作用相反。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

为了检测 1-Azakenpaullone 在肾小球损伤的潜在作用，使用 0.25  $\mu\text{M}$  1-Azakenpaullone 处理曲霉毒素诱发肾小球损伤斑马鱼模型，与未给予 1-Azakenpaullone 组相比，给药组心包水肿面积显著减少，说明 1-Azakenpaullone 可有效保护曲霉毒素诱发的肾小球损伤。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Shin S, et al. Glycogen synthase kinase-3 $\beta$  positively regulates protein synthesis and cell proliferation through the regulation of translation initiation factor 4E-binding protein 1. *Oncogene*. 2014 Mar 27;33(13):1690-9.
- [2]. Lee HW, et al. High-content screening assay-based discovery of paullones as novel podocyte-protective agents. *Am J Physiol Renal Physiol*. 2018 Feb 1;314(2): F280-F292.
- [3] Liu H, et al. Glycogen synthase kinase-3 and mammalian target of rapamycin pathways contribute to DNA synthesis, cell cycle progression, and proliferation in human islets. *Diabetes*. 2009 Mar;58(3):663-72.
- [4] Duffy DJ, et al. GSK3 inhibitors regulate MYCN mRNA levels and reduce neuroblastoma cell viability through multiple mechanisms, including p53 and Wnt signaling. *Mol Cancer Ther*. 2014 Feb;13(2):454-67.
- [5] Kunick C, et al. 1-Azakenpaullone is a selective inhibitor of glycogen synthase kinase-3 beta. *Bioorg Med Chem Lett*. 2004 Jan 19;14(2):413-6.