

A-769662 (A769662)

产品信息

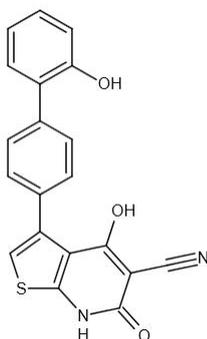
产品名称	产品编号	规格
A-769662 (A769662)	52402ES08	5 mg
	52402ES25	25 mg

产品描述

A-769662 (A769662; A 769662)是一种强效且可逆的 AMPK (AMP 活化蛋白激酶) 激活剂, 通过影响其 β 亚基碳水化合物结合区和亚基残基, 并非直接作用 AMP 结合位点的这种独特方式来活化 AMPK。另外, A-769662 只激活包含 $\beta 1$ 亚基的 AMPK 异构体。A-769662 直接激活部分纯化的大鼠肝脏 AMPK ($EC_{50} = 0.8 \mu M$), 并抑制原代大鼠肝细胞中脂肪酸的合成($IC_{50} = 3.2 \mu M$)。大鼠体内实验显示 A-769662 将会是一种治疗 II 型糖尿病和代谢综合征的有力途径。A-769662 通过 AMPK 非依赖机制抑制 26S 蛋白酶体的非蛋白酶活性组分功能, 可逆的抑制蛋白酶体活性, 并引起细胞周期停滞。A-769662 通过下调成脂细胞相关转录因子和标记物来抑制 3T3-L1 细胞分化, 另外还可以降低分化和成熟 3T3-L1 细胞的细胞活力, 过度激活 AMPK 从而增加乙酰 CoA 羧化酶(ACC)磷酸化并使之失活。A-769662 是很有潜力的治疗肥胖症的药物。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	A 769662; A769662; A-769662
中文名称 (Chinese Name)	AMPK 激活剂
靶点 (Target)	AMPK
CAS 号 (CAS NO.)	844499-71-4
分子式 (Formula)	$C_{20}H_{12}N_2O_3S$
分子量 (Molecular Weight)	360.39
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 97\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥ 20 mg/mL
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 $-20^{\circ}C$, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 $-20^{\circ}C$ 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) 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）

A-769662 对杆状病毒表达的 AMPK 的 $\alpha 1$ 、 $\beta 1$ 、 $\gamma 1$ 重组亚型 ($EC_{50}=0.7 \mu M$) 具有同样的激活作用。A-769662 和 A-592107 以剂量反应的方式激活从多个组织和物种中纯化的 AMPK，可观察到 EC_{50} 略有变化。用大鼠心脏、肌肉或人胚胎肾细胞(HEKs) 部分纯化 AMPK 提取物测定 A-769662 的 EC_{50} 值分别是 $2.2 \mu M$ 、 $1.9 \mu M$ 、 $1.1 \mu M$ 。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

A-769662 (30 mg/kg; 口服给药) 处理 SD 大鼠，发现呼吸交换指数(RER)和丙二酰 CoA 水平显著降低。A-769662 (30 mg/kg) 可显著降低糖尿病 ob/ob 小鼠的血糖（降低 30%-40%）。^[1]

参考文献

[1]. Cool B, et al. Identification and characterization of a small molecule AMPK activator that treats key components of type 2 diabetes and the metabolic syndrome. Cell Metab, 2006, 3(6), 403-416.