



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Lixumistat acetate (IM156; HL156A; HL271 acetate)**
CAS 号: **1422365-93-2**
产品货号: **S89008**

生物活性:

Description	Lixumistat (IM156; HL156A; HL271) acetate 是二甲双胍的化学衍生物，是一种强效的，具有口服活性的 AMPK 激活剂。Lixumistat (acetate) 在动物模型中可缓解与年龄相关的认知障碍。Lixumistat (acetate) 是一种有效的氧化磷酸化 (OXPHOS) 抑制剂，可用于实体肿瘤的研究。				
IC50 & Target	AMPK[1][2], OXPHOS[3]				
In Vitro	Lixumistat acetate (0.31-10 μM) 以剂量和时间依赖性方式在 NIH3T3 小鼠成纤维细胞中磷酸化 AMPK α 1 Thr172[1]。				
	Lixumistat acetate 不会影响参与葡萄糖稳态的关键因子的表达，例如葡萄糖-6-磷酸酶 (G6pase) 或磷酸烯醇丙酮酸羧激酶 1 (Pck1)[1]。				
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	NIH3T3 cells			
	Concentration:	0.31μM, 0.62μM, 1.25μM, 2.5μM, 5μM, 10μM			
	Incubation Time:	4 hours			
	Result:	Significantly increased the AMPK phosphorylation rate.			
In Vivo	Lixumistat acetate 不会影响饮食诱导性肥胖小鼠的体重、血糖、胰岛素水平和脂质代谢物含量评估的代谢调节[1]。				
	Lixumistat acetate (50 mg/kg; 持续 2 个月) 不会影响体重、一般运动能力或焦虑[2]。				
	Lixumistat acetate 可显著减轻衰老引起的新物体识别记忆和空间工作记忆的下降[2]。				
	Lixumistat acetate 可显著增加老年小鼠海马中的 AMPK 活化[2]。				
	Animal Model:	C57BL/6J mice (young group/12-16 weeks, old groups/20-22 months)[2]			
	Dosage:	50 mg/kg			
	Administration:	Oral administration (drinking water), for 2 months			
Result:	Attenuated age-related cognitive decline.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (133.21 mM; 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.6642 mL	13.3209 mL	26.6418 mL
		5 mM	0.5328 mL	2.6642 mL	5.3284 mL
		10 mM	0.2664 mL	1.3321 mL	2.6642 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。				
	储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。				
	动物实验:				
	请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。				
以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用；					



	以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.66 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.66 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.66 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Row H, et al. HL271, a novel chemical compound derived from metformin, differs from metformin in its effects on the circadian clock and metabolism. Biochem Biophys Res Commun. 2016 Jan 15;469(3):783-9. [2]. Bang E, et al. The Improving Effect of HL271, a Chemical Derivative of Metformin, a Popular Drug for Type II Diabetes Mellitus, on Aging-induced Cognitive Decline. Exp Neurobiol. 2018 Feb;27(1):45-56. [3]. Sun Young Rha, et al. Phase I study of IM156, a novel potent biguanide oxidative phosphorylation (OXPHOS) inhibitor, in patients with advanced solid tumors. Journal of Clinical Oncology 38(15_suppl):3590-3590.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.6642 mL	13.3209 mL	26.6418 mL	66.6045 mL
	5 mM	0.5328 mL	2.6642 mL	5.3284 mL	13.3209 mL
	10 mM	0.2664 mL	1.3321 mL	2.6642 mL	6.6605 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

	15 mM	0.1776 mL	0.8881 mL	1.7761 mL	4.4403 mL
	20 mM	0.1332 mL	0.6660 mL	1.3321 mL	3.3302 mL
	25 mM	0.1066 mL	0.5328 mL	1.0657 mL	2.6642 mL
	30 mM	0.0888 mL	0.4440 mL	0.8881 mL	2.2202 mL
	40 mM	0.0666 mL	0.3330 mL	0.6660 mL	1.6651 mL
	50 mM	0.0533 mL	0.2664 mL	0.5328 mL	1.3321 mL
	60 mM	0.0444 mL	0.2220 mL	0.4440 mL	1.1101 mL
	80 mM	0.0333 mL	0.1665 mL	0.3330 mL	0.8326 mL
	100 mM	0.0266 mL	0.1332 mL	0.2664 mL	0.6660 mL



源叶