



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: shyysw@sina.com

产品名称: **Fasentin**
CAS 号: **392721-37-8**
产品货号: **S89050**

生物活性:

Description	Fasentin 是有效的葡萄糖摄取抑制剂, 可抑制 GLUT-1/GLUT-4 转运蛋白。Fasentin 优先抑制 GLUT4 (IC50=68 μM)。Fasentin 是死亡受体刺激 (FAS) 敏化剂, 可敏化细胞对 FAS 诱导的细胞死亡。Fasentin 也是诱导肿瘤坏死因子 (TNF) 凋亡配体的敏化剂。Fasentin 阻断癌细胞系中的葡萄糖摄取, 并具有抗血管生成活性。	
IC50 & Target[1][3]	GLUT4 68 μM (IC50)	GLUT1
In Vitro	Fasentin (0.1-1000 μM; 72 小时) 抑制内皮细胞、肿瘤细胞和成纤维细胞的生长, 而不诱导细胞死亡[1]。 Fasentin (25-100 μM; 16-24 hours) 诱导细胞周期停滞在 G0/G1 期, 并以剂量依赖的方式减少 S 期细胞数量[1]。 Fasentin (50 μM; 16 小时) 改变与葡萄糖剥夺相关的基因的表达, 例如 AspSyn 和 PCK-2[2]。 Fasentin (15、30、80 μM; 预处理 1 小时) 诱导葡萄糖剥夺, 部分阻断 PPC-1、DU145 和 U937 细胞中的葡萄糖摄取[2]。 Fasentin (100 μM; 16 hours) 不影响内皮细胞的迁移能力[1]。 Fasentin (25-100 μM; 16 小时) 降低 HMEC 中磷酸化 ERK 的水平, 表明对 ERK 信号通路的部分抑制, 尽管该作用在统计学上不显著。Fasentin 不抑制 VEGFR2 的酪氨酸激酶活性[1] 。 Fasentin 与 GLUT1 细胞内通道中的一个独特位点相互作用[3]。	
In Vivo	Cell Viability Assay[1]	
	Cell Line:	Three types of endothelial cells ECs (HMEC, human microvascular endothelial cells; HUVEC, human umbilical vein endothelial cells; and BAEC, bovine aortic endothelial cells), three human tumour cell lines (MDA-MB-231 and MCF7 breast carcinoma cells, and HeLa cervix adenocarcinoma cells), and human gingival fibroblasts (HGF)
	Concentration:	0.1, 1, 10, 100, 1000 μM
	Incubation Time:	72 hours
	Result:	Inhibited endothelial, tumour and fibroblast cell growth (IC50=26.3-111.2 μM) without inducing cell death.
	Cell Cycle Analysis[1]	
	Cell Line:	HMECs
	Concentration:	25, 50, 100 μM
	Incubation Time:	16, 24 hours
	Result:	Induced a cell cycle arrest in G0/G1 phase and reduced the cell number in S phase in a dose-dependent manner. Did not increase the subG1 population.
RT-PCR[2]		
Cell Line:	PPC-1 cells[2]	
Concentration:	50 μM	
Incubation Time:	16 hours	



	Result:	Altered expression of genes associated with glucose deprivation such as AspSyn and PCK-2 not FLIP mRNA expression.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (357.60 mM; 超声助溶; 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	3.5760 mL	17.8801 mL	35.7603 mL
		5 mM	0.7152 mL	3.5760 mL	7.1521 mL
		10 mM	0.3576 mL	1.7880 mL	3.5760 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. -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 (8.94 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 ddH ₂ O 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 (8.94 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 生理盐水电溶液 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 (8.94 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]. M^a Carmen Ocaña, et al. Fasentin diminishes endothelial cell proliferation, differentiation and invasion in a glucose metabolism-independent manner. Sci Rep. 2020 Apr 9;10(1):6132.
- [2]. Tabitha E Wood, et al. A novel inhibitor of glucose uptake sensitizes cells to FAS-induced cell death. Mol Cancer Ther. 2008 Nov;7(11):3546-55.
- [3]. Qin Wu, et al. GLUT1 inhibition blocks growth of RB1-positive triple negative breast cancer. Nat Commun. 2020 Aug 21;11(1):4205.

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。 -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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.5760 mL	17.8801 mL	35.7603 mL	89.4007 mL
	5 mM	0.7152 mL	3.5760 mL	7.1521 mL	17.8801 mL
	10 mM	0.3576 mL	1.7880 mL	3.5760 mL	8.9401 mL
	15 mM	0.2384 mL	1.1920 mL	2.3840 mL	5.9600 mL
	20 mM	0.1788 mL	0.8940 mL	1.7880 mL	4.4700 mL
	25 mM	0.1430 mL	0.7152 mL	1.4304 mL	3.5760 mL
	30 mM	0.1192 mL	0.5960 mL	1.1920 mL	2.9800 mL
	40 mM	0.0894 mL	0.4470 mL	0.8940 mL	2.2350 mL
	50 mM	0.0715 mL	0.3576 mL	0.7152 mL	1.7880 mL
	60 mM	0.0596 mL	0.2980 mL	0.5960 mL	1.4900 mL
	80 mM	0.0447 mL	0.2235 mL	0.4470 mL	1.1175 mL
	100 mM	0.0358 mL	0.1788 mL	0.3576 mL	0.8940 mL