

### Umbralisib (TGR-1202)

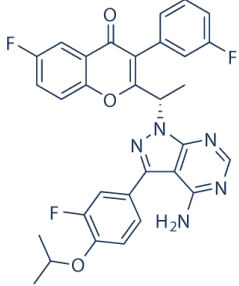
产品编号: MB2611

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg/25mg

产品形式: solid

#### 基本信息

分子式	C31H24F3N5O3	结构式	
分子量	571.55		
CAS No.	1532533-67-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 100 mg/mL (174.96 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
	Ethanol: 6 mg/mL (10.50 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
	Water: Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介:** TGR-1202 是一种新型的 PI3K $\delta$ 抑制剂, 在酶学研究中和在细胞研究中, 其抑制 PI3K $\delta$ 活性的 IC50 和 EC50 分别为 22.2 nM 和 24.3 nM。

#### 物理性状及指标:

外观: .....粉末

溶解性: .....DMSO: 100 mg/mL (174.96 mM) (warmed with 50℃ water bath); Ethanol: 6 mg/mL (10.50 mM) (warmed with 50℃ water bath); Water: Insoluble

含量: .....>98%

**储存温度:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

#### 生物活性

<b>描述</b>	TGR-1202 是一种新型的 PI3K $\delta$ 抑制剂, 在酶学研究中和在细胞研究中, 其抑制 PI3K $\delta$ 活性的 IC50 和 EC50 分别为 22.2 nM 和 24.3 nM。	
<b>IC50 &amp; Target</b>	PI3K $\delta$ (Cell-free assay)	
	22.2 nM	
<b>体内</b>	TGR-1202 (RP5264) 在啮齿类动物中, 具有良好的口服吸收能力, 有利的药代动力学属性。体内安全性良好。	

体外	TGR-1202 对 PI3K $\alpha$ 、 $\beta$ 、 $\gamma$ 、 $\delta$ 中，对 PI3K $\delta$ 的选择性较高。TGR-1202 抑制人类全血 CD19 细胞的增殖，IC50 的范围在 100-300 nM 之间。对 PBMC 处理 TGR-1202 (RP5264) 将导致 G2/M 期阻滞，然后处于 sub-G0 期的细胞增多。细胞生存力实验显示，该化合物将引起永生白血病细胞和原代白血病细胞的显著生长抑制，Akt 磷酸化被抑制。
细胞实验	Cell lines: 耐受型和敏感型多发性骨髓瘤细胞 (MM-1R 和 MM-1S 细胞) Concentrations: -- Incubation Time: 96 h Method: 用不同浓度的 RP5264 对 MM1-R 和 MM1-S 细胞进行处理，96 小时后，通过 MTT 试验检测细胞生长情况。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: Female Balb/c mice Formulation: -- Dosages: 12.5, 25, 50 mg/kg Administration: 口服 (Only for Reference)

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB0768	LY294002 HCl
MB3331	Idelalisib;CAL101
MB3524	GSK2269557

**储液配置及储存：**按表中溶解性配置；如溶解困难，可以通过快速搅拌，超声或温和加热（在 45-60°C 下水浴）。液体稳定性报道的很少，建议现配现用，如需储存，建议：-20°C 1-3 月；-80°C 3-6 月。

体 浓度	DMSO 质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7496 mL	8.7481 mL	17.4963 mL
5 mM	0.3499 mL	1.7496 mL	3.4993 mL
10 mM	0.1750 mL	0.8748 mL	1.7496 mL
50 mM	0.0350 mL	0.1750 mL	0.3499 mL

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

#### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，

长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。