

AZD-6482 ; AZD6482

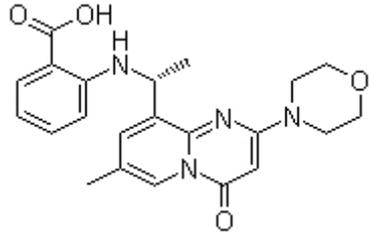
产品编号：MB3883

质量标准：>98%，PI3Kβ 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C22H24N4O4	结构式	
分子量	408.45		
CAS No.	1173900-33-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 82 mg/mL (200.75 mM)		
	Ethanol : 10 mg/mL (24.48 mM)		
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：AZD6482 是 PI3Kb 的一种具有异位选择性和强效 ATP 竞争性抑制剂。

别名：AZD 6482 ; KIN 193 ;

(-) 2-[1-(7-methyl-2-(morpholin-4-yl)-4-oxo-4H-pyrido[1,2-a]pyrimidin-9-yl)ethylamino]benzoic acid

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 82 mg/mL (200.75 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 10 mg/mL (24.48 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	AZD6482 是 PI3Kβ 抑制剂，IC50 为 10 nM,作用于 PI3Kβ 比作用于 PI3Kδ, PI3Kα 和 PI3Kγ 选择性分别高 8,86, 和 109 倍。			
靶点	PI3Kβ	PI3Kα	PI3Kγ	PI3Kδ
IC50	21 nM	1.4 μM	1.2 μM	80 nM
体外研究	AZD6482 是 PI3Kβ 抑制剂，IC50 为 21 nM, 然而, AZD6482 也抑制 PI3Kα,γ,和 δ, IC50 为 80 nM 到 1.4 μM, 明显比其(+)-对映异构体(S 型)低很多。AZD6482 是抗血小板药，在洗涤血小板聚集(WPA)实验中，抑制活化血小板粘附/聚集，且促进血小板解聚，IC50 为 6 nM。而且, AZD6482 靶向作用于 PI3Kβ，特定抑制血栓形成而不影响正常止血。因此, AZD6482 作为抗血栓药，用于预防血栓疾病。			
特征	AZD6482 是 PI3Kβ 抑制剂，作为抗血小板和抗血栓的药物。			

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)

MB3367	GSK2636771
MB5532	BYL719
MB3886	GDC-0032

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。AZD6482 是 PI3Kb 的一种具有异位选择性和强效 ATP 竞争性抑制剂。AZD6482 在不增加出血时间或失血的情况下对人类和狗产生抗血栓作用。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量			
	积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.4483 mL	12.2414 mL	24.4828 mL
5 mM		0.4897 mL	2.4483 mL	4.8966 mL
10 mM		0.2448 mL	1.2241 mL	2.4483 mL
50 mM		0.0490 mL	0.2448 mL	0.4897 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>抑制 PI3K 酶实验: 通过 AlphaScreen 酶活性测定使用人重组酶测定对 PI3Kβ, PI3Kα, PI3Kγ 和 PI3Kδ 的抑制效果。该法测量 PI3K 调节的 PIP2 和 PIP3 之间的转换。生物素化的 PIP3, 即 GST-标记的血小板-白细胞 C 激酶底物同源(PH) 域和两个 AlphaScreen 磁珠形成复合体, 在 680 nm 处形成激光信号。在酶反应复合体中形成的 PIP3 与生物素化的 PIP3 竞争性结合到 PH 域, 引起提高酶产物, 降低信号。AZD6482 溶于 DMSO, 加到 385 孔板上。PBKβ, PBKα, PBKγ, 或 PBKδ 加到 Tris buffer(50 mM Tris pH 7.6, 0.05% CHAPS, 5 mM DTT, 和 24 mM MgCl₂) 中, 和 AZD6482 预温育 20 分钟, 然后加入含 PIP2 和 ATP 的底物溶液。20 分钟后, 加入含 EDTA 和生物素-PIP3 的终止液, 而终止酶反应, 随后加入含 GST-grp1 PH 和 AlphaScreen 磁珠的检测液。实验板在暗中放置最少 5 小时, 然后用于实验分析。实验中 DMSO, ATP 和 PIP2 的最终浓度分别为 0.8%, 4 μM, 和 40 μM。计算 IC50 值。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: 人血小板颗粒 Concentrations: 0-60 nM, 溶于 DMSO Incubation Time: 5 分钟 Method: 在洗涤血小板聚集 (WPA) 实验中, 从人血液中分离血小板颗粒, 再悬浮在含 1 μM 水蛭素和 0.02 U/mL 三磷酸腺苷双磷酸酶的 2×10^{15}/L Tyrodes buffer 中。然后, 血小板悬浮液在室温下搁置 30 分钟。实验开始前, 加入 CaCl₂, 终浓度为 2 mM。AZD6482, 溶于 DMSO, 加到 96 孔板中, 然后加入洗涤的血小板悬液。血小板悬液和 AZD6482 预温育 5 分钟。在 650 nm 处记录吸光值, 然后震荡板 5 分钟再记录吸光值, 记为 R0 和 R1。每孔加入特定浓度的小鼠 抗人 CD9 抗体, 震荡板 10 分钟, 记录吸光值, 记为 R2。用于数据分析, 除去所有数据中和 TB 结合而测定的吸光值, 然后根据公式: $[(R1-R2)/R1] \times 100$ 计算聚集百分数。另外, 根据同样公式 $[(R0-R1)/R0] \times 100$ 评定抑制剂的自发聚集效果。然后测定 IC50 值。</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做好预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。

●部分产品我司仅能提供部分信息，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。