RG-7604；GDC0032；GDC-0032

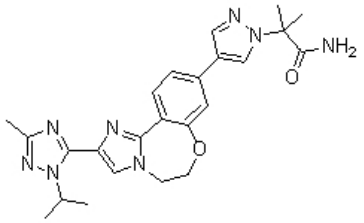
产品编号：MB3886

质量标准：>98%，选择性的 PI3Kα/β/δ/γ 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C24H28N8O2	结构式	
分子量	460.53		
CAS No.	1282512-48-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 92 mg/mL (199.77 mM)		
	Water Insoluble		
	Alcohol 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：GDC-0032 是一种有效的 PI3K 抑制剂，能够抑制 PI3Kα，PI3Kβ 和 PI3Kγ 的活性。

别名：GDC-0032; RG-7604；1H-Pyrazole-1-acetamide, 4-[5,6-dihydro-2-[3-methyl-1-(1-methylethyl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl]imidazo[1,2-d][1,4]benzoxazepin-9-yl]-α,α-dimethyl

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO 92 mg/mL (199.77 mM)；Water Insoluble；Alcohol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Taselisib (GDC 0032)是一种有效，下一代的 β 亚型 PI3K 抑制剂，作用于 PI3Kα/δ/γ， IC50 分别为 0.29 nM/0.12 nM/0.97nM，比作用于 PI3Kβ 选择性高 10 倍以上。				
靶点	PI3Kδ (Cell-free assay)	PI3Kα (Cell-free assay)	PI3Kγ (Cell-free assay)	PI3Kβ (Cell-free assay)	C2β (Cell-free assay)
	0.12 nM(Ki)	0.29 nM(Ki)	0.97 nM(Ki)	9.1 nM(Ki)	292 nM
体内研究	GDC-0032 是口服生物有效的，选择性 I 型 PI3Kα，δ 和 γ 亚型抑制剂，抑制 PI3Kβ 亚型比抑制 PI3Kα 亚型效果低 30 倍。临床前期数据表明，GDC-0032 作用于 PI3Kα 亚型(PIK3CA)突变型和 HER2 扩增的肿瘤细胞系，活性增加。GDC-0032 抑制 MCF7-neo/HER2 细胞增殖，IC50 为 2.5 nM。				
体外研究	GDC-0032 药代动力学是剂量呈比例的，与时间无关的，平均 $t_{1/2}$ 为 40 小时。GDC-0032 与 Fulvestrant 联用，增强 Fulvestrant 活性，导致肿瘤衰退，延迟肿瘤生长（肿瘤生长抑制率（TGI）为 91%）。此外，GDC-0032 与 Tamoxifen 联用，增强 Tamoxifen 在体内的疗效（GDC-0032 的 TGI 为 102%）。				

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)

MB5302	VS-5584
MB5319	XL-147
MB5695	NVP-BKM120
MB3890	PF-04691502

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。GDC-0032 是一种有效的 PI3K 抑制剂，能够抑制 PI3Kα，PI3Kβ 和 PI3Kγ 的活性。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 \ 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1714 mL	10.8571 mL	21.7141 mL
5 mM	0.4343 mL	2.1714 mL	4.3428 mL
10 mM	0.2171 mL	1.0857 mL	2.1714 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	**体外生化与细胞活性表征:** 通过荧光偏振检测测量 I 型 PI3K 亚型的酶活性，监测产物 3,4,5-肌醇三磷酸分子的形成，因为它与荧光标记的 PIP3 竞争性结合到 GRP-1 pleckstrin 同源结构域。磷脂酰肌醇-3 -磷酸产物增加，导致荧光偏振信号减少，标记的荧光 GRP-1 蛋白结合位点被取代。I 型 PI3K 亚型表达和纯化，作为异二聚体重组蛋白。购买 Tetramethylrhodamine-标记的 PIP3(TAMRA-PIP3), di-C8-PIP2, 和 PIP3 检测试剂。在 10 mM Tris (pH 7.5), 25 μM ATP, 9.75 μM PIP2, 5%甘油，4 mM $MgCl_2$, 50 mM NaCl, 0.05% (v/v) Chaps, 1 mM 二硫苏糖醇, 和 2% (v/v) DMSO 60 ng/mL 存在时，检测初始速率条件下 PI3Kα。在 25°C 进行 30 分钟, 然后加入 9 mM EDTA, 4.5 nM TAMRA-PIP3,和 4.2 μg/mL GRP-1 检测蛋白终止反应，在 Envision 酶标仪上读取荧光偏振。根据四参数方程拟合剂量-反应曲线，计算 IC50 值。每个值取三组实验的平均值，标准偏差小于几何平均值。
动物实验	**Animal Models:** MCF7-neo/Her2 移植瘤模型 **Formulation:** 0.5% 甲基纤维素和 0.2% Tween-80 **Dosages:** 1.4, 2.8, 5.8, 11.25, 或 22.5 mg/kg **Administration:** 口服处理

【注意】

●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。