

## BGT226 ; NVP-BGT226

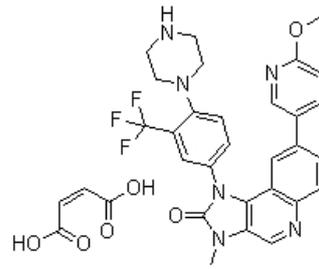
产品编号 : MB3888

质量标准 : >98% , I 型 PI3K/mTOR 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C <sub>28</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> .C <sub>4</sub> H <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	结 构 式	
分子量	650.6		
CAS No.	1245537-68-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 30 mg/mL (46.11 mM) Water Insoluble Ethanol 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 :** NVP-BGT226 是一种有效的泛 I 类 PI3K 和 mTOR 抑制剂, 抑制 PI3K $\alpha$ , PI3K $\beta$  和 PI3K $\gamma$ 。

**别名 :** NVP-BGT226 ; NVP BGT

226;1-(3-(Trifluoromethyl)-4-(piperazin-1-yl)phenyl)-8-(6-methoxypyridin-3-yl)-3-methyl-1H-imidazo[4,5-c]quinolin-2(3H)-one maleic acid salt

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 30 mg/mL (46.11 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	BGT226 (NVP-BGT226)是一种新型 I 型 PI3K/mTOR 抑制剂, 作用于 PI3K $\alpha$ / $\beta$ / $\gamma$ , IC <sub>50</sub> 为 4 nM/63 nM/38 nM			
<b>靶点</b>	mTOR	PI3K $\alpha$ (filter-binding assay)	PI3K $\gamma$ (filter-binding assay)	PI3K $\beta$ (filter-binding assay)
		4 nM	38 nM	63 nM
<b>体外研究</b>	生长抑制实验显示 NVP-BGT226 具有抗肿瘤活性。NVP-BGT226 显著抑制细胞生长, IC <sub>50</sub> < 20 nM。NVP-BGT226 在纳摩尔浓度时也诱导癌细胞凋亡, IC <sub>50</sub> ≤ 25 nM。NVP-BGT226 抗增殖和促凋亡效果不依赖于 bcr-abl 状态。NVP-BGT226 抑制 AKT/mTOR 信号通路激活, 这种作用存在浓度和时间依赖性。流式细胞仪分析显示细胞在 G(0)-G(1) 期累积, 随后在 S 期减少。NVP-BGT226 作用于测试细胞包括 SCC4, TU183 和 KB 细胞系, 有效抑制生长, IC <sub>50</sub> 为 7.4 到 30.1 nM。NVP-BGT226 处理表达 PIK3CA 突变 H1047R 的 Detroit 562 和 HONE-1 细胞,			

	<p>也有效抑制生长。此外, NVP-BGT226 作用于 HONE-1 细胞和抗 cisplatin 细胞的效果差不多。端脱氧核苷酸转移酶调节的 dUTP 缺口末端标记法 (法) (TUNEL) , 及 caspase 3/7 和 PARP 分析, 说明 NVP-BGT226 通过凋亡路径诱导细胞死亡。NVP-BGT226 通过微管相关蛋白轻链 3B-II 的凝聚和上调, 及 p62 的降解, 诱导自噬。Beclin1 的基因沉默或与自噬体抑制剂, 3-methyladenine 一起处理, 抑制 NVP-BGT226 诱导的自噬, 且恢复菌落存活。NVP-BGT226 在纳摩尔浓度时作用于常见骨髓瘤细胞系和原代骨髓瘤细胞(如 NCI-H929, U266, RPMI-8226 和 OPM2 多发性骨髓瘤细胞系), 抑制生长, 这种作用存在时间和剂量依赖性。NVP-BGT226 抑制蛋白激酶 B(Akt), P70S6k 和 4E-BP-1 磷酸化, 这种作用存在时间和剂量依赖性。NVP-BGT226 完全抑制胰岛素类生长因子 1, 白细胞介素-6, 和 HS-5 基质细胞的条件培养基对骨髓瘤细胞生长的刺激作用。NVP-BGT226 可作为治疗多发性骨髓瘤的新型候选药。NVP-BGT226 有效诱导凋亡和 抑制增殖。</p>
<p><b>体内研究</b></p>	<p>NVP-BGT226 作用于移植瘤动物模型, 明显延迟肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 且伴随着抑制 p-p70 S6 激酶细胞质表达和自噬小体形成。NVP-BGT226 作用于 FaDu 细胞移植瘤鼠模型, 抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性。NVP-BGT226 按 2.5 和 5 mg/kg 剂量口服处理三周, 在第 21 天, 与对照组相比, 引起肿瘤生长分别下降 34.7%和 76.1%。NVP-BGT226 与 rapamycin 相比, 抑制肿瘤生长效果更好一些。NVP-BGT226 处理组肿瘤最终体积明显比 LY294002 处理组和对照组小很多。</p>

**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)**

<p>MB3887</p>	<p>IC-87114</p>
<p>MB5532</p>	<p>BYL719</p>
<p>MB3572</p>	<p>CAY10505</p>

**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。BGT226 (NVP-BGT226)是一种新型 I 型 PI3K/mTOR 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

<p>体 质 浓度 积 量</p>	<p>1 mg</p>	<p>5 mg</p>	<p>10 mg</p>
<p>1 mM</p>	<p>1.5370 mL</p>	<p>7.6852 mL</p>	<p>15.3704 mL</p>
<p>5 mM</p>	<p>0.3074 mL</p>	<p>1.5370 mL</p>	<p>3.0741 mL</p>
<p>10 mM</p>	<p>0.1537 mL</p>	<p>0.7685 mL</p>	<p>1.5370 mL</p>
<p>50 mM</p>	<p>-</p>	<p>-</p>	<p>-</p>

**经典实验操作 (仅供参考)**

<p><b>细胞实验:</b></p>	<p>Cell lines: NCI-H929, U266, RPMI-8226 和 OPM2 多发性骨髓瘤细胞 Concentrations: 20-250 nM Incubation Time: 36 小时 Method: NCI-H929,U266,RPMI-8226 和 OPM2 多发性骨髓瘤细胞按每孔 1.5×10<sup>4</sup> 个细胞接种在 96 孔板上, 孔中有含 10% FBS 的 RPMI 培养基。36 小时后, 加入 BrdU 标签溶液(终浓度为 10 μM), 细胞在湿润环境下再培养 12 小时(37oC/5% CO<sub>2</sub>)。然后在 300 g 转速下离心 10 分钟, 除去上清液。然后在 60oC 烘干 2 小时。用乙醇/HCl 在 -20oC 下固定 30 分钟,用核酸酶在 37oC 下处理 30 分钟, DNA 部分被消化。细胞用培养基冲洗三次,</p>
---------------------	--

	然后与 anti-BrdU-POD 标签溶液在 37°C 下温育 30 分钟。移除 anti-POD 溶液细胞用冲洗 buffer 冲洗三次。加入 ABTS 底物溶液，使用酶标仪在 405 nm 测定吸光值。
动物实验：	Animal Models: 携带人类 FaDu 移植瘤的鼠 Formulation: 90% N-甲基-2-吡咯烷酮(NMP)/10% PEG300 Dosages: 5 mg/kg, 处理三周 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，请选择用合适溶剂 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。给药剂量的时候，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(M <sup>2</sup> )	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。