

Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective

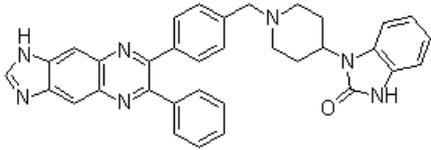
产品编号：MB4288

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

| | | | |
|---------------|--|-------------|--|
| 分子式 | C34H29N7O | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 551.64 | | |
| CAS No. | 612847-09-3 | | |
| 储存条件 | -20°C，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 22 mg/mL (39.88 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：AKT inhibitor VIII 是一种细胞渗透的喹喔啉化合物，能够有效的，选择性的，可逆的抑制 Akt1，Akt2 和 Akt3 的活性。

别名：AKTi-1/2；2H-Benzimidazol-2-one, 1,3-dihydro-1-[1-[[4-(6-phenyl-1H-imidazo[4,5-g]quinoxalin-7-yl)phenyl]methyl]-4-piperidinyl]-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 22 mg/mL (39.88 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

| | | | |
|-------------|---|---------------------------|---------------------------|
| 产品描述 | Akti-1/2 是高度选择性的 Akt1/Akt2 抑制剂，IC50 分别为 58 nM/210 nM，对 Akt1 的选择性比对 Akt3 高 36 倍。 | | |
| 靶点 | Akt1 (Cell-free assay) | Akt2 (Cell-free assay) | Akt3 (Cell-free assay) |

| | | | |
|-------------|--|--------|---------|
| | 58 nM | 210 nM | 2119 nM |
| 体外研究 | 在基于细胞的 IPKA (C33A) 试验中, Akti-1/2 抑制 Akt1 和 Akt2, IC50 分别为 305 nM 和 2086 nM。在 HT29, MCF7, 和 A2780 细胞中, Akti-1/2 通过急剧增加 caspase-3 活性诱导细胞凋亡。在肝细胞中, Akti-1/2 阻断胰岛素调节 PEPCK, G6Pase 表达, 和 FOXO1 活性。Akti-1/2 也会通过阻断 PKB 强烈增强 PAR-1-介导的血小板聚集。在 HCC827, NCI-H522, NCI-1651, 和 PC-9 细胞中, Akti-1/2 抑制细胞生长, IC50 为 4.7 μM, 7.25 μM, 和 9.5 μM, 结合 gefitinib 时, Akti-1/2 会增强细胞生长和凋亡的抑制。 | | |
| 体内研究 | 在小鼠中, Akti-1/2 (50 mg/kg, i.p.) 抑制肺中基底和 IGF-刺激的 Akt1 和 Akt2 磷酸化作用。 | | |

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)

| | |
|--------|------------------------|
| MB3650 | A-674563 |
| MB4498 | AT13148 |
| MB4497 | GSK-2141795,Uprosertib |

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。AKT inhibitor VIII 是一种细胞渗透的喹啉化合物, 能够有效的, 选择性的, 可逆的抑制 Akt1, Akt2 和 Akt3 的活性。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 | 1.8128 mL | 9.0639 mL | 18.1278 mL |
| 5 mM | 0.3626 mL | 1.8128 mL | 3.6256 mL |
| 10 mM | 0.1813 mL | 0.9064 mL | 1.8128 mL |
| 50 mM | - | - | - |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|-------------|---|
| 激酶实验 | 激酶筛选: 简而言之, 所有试验(25.5 μl 在 21°C 下进行 30 min)使用 Biomek 2000 实验室自动化工作站在 96 孔格式中进行。反应包含 5-20 mU 纯化的激酶和底物肽或蛋白质, 通过加入 10 mM 乙酸镁和 5, 20, 或 50 μM ATP ([γ- ³³ P]-ATP, 800 cpm/pmol)起始。 |
| 细胞实验 | Cell lines: HCC827, NCI-H522, NCI-1651, 和 PC-9 细胞 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 96 小时 |

Method: AKTi-1/2 的细胞生长抑制作用使用 96 小时磺酰罗丹明 B 试验(SRB)研究。每个化合物抑制 50%细胞生长的浓度(IC50)在 GraphPad Prism 6.0 中使用非线性回归分析和 S 形剂量-反应(可变斜率)方程计算。

【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，否则会严重影响化合物活性，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。