

## GDC-0068(GDC0068) ; RG7440 ; Ipatasertib

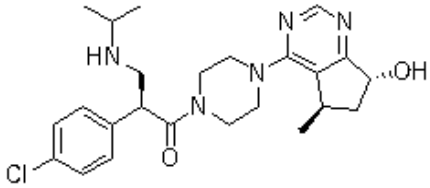
产品编号 : MB5663

质量标准 : >98%,高选择性的 pan-Akt 抑制剂

包装规格 : 5MG;20MG;100MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	结 构 式	
分子量	458.00		
CAS No.	1001264-89-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 92 mg/mL (200.87 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 92 mg/mL (200.87 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 :** Ipatasertib (GDC-0068) 是一种选择性, 竞争性的 pan-Akt 抑制剂, 抑制 Akt1, Akt2, Akt3。

**别名 :** GDC-0068; RG7440 ; 1-Propanone, 2-(4-chlorophenyl)-1-[4-[(5R,7R)-6,7-dihydro-7-hydroxy-5-methyl-5Hcyclopentapyrimidin-4-yl]-1-piperazinyl]-3-[(1-methylethyl)amino]-, (2S)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至卡其色固体

溶解性 : .....DMSO : 92 mg/mL (200.87 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 92 mg/mL (200.87 mM)

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>	GDC-0068 是高选择性 pan-Akt 抑制剂, 靶向作用于 Akt1/2/3, IC <sub>50</sub> 为 5 nM/18 nM/8 nM,比作用于 PKA 选择性高 620 倍。		
<b>靶点</b>	Akt1	Akt2	Akt3
<b>IC<sub>50</sub></b>	5 nM	18 nM	8 nM

<b>体外研究</b>	对一大组 230 种激酶测试, GDC-0068 只抑制 3 种激酶, 浓度为 1 $\mu$ M 时抑制 70%以上,(抑制 PRKG1 $\alpha$ ,PRKG1 $\beta$ ,和 p70S6K 时, IC50 分别为 98 nM, 69 nM, 和 860 nM)。GDC-0068 作用于 Akt 比作用于 PKA 选择性高 100 倍以上, 抑制 Akt 时 IC50 为 3.1 $\mu$ M。GDC-0068 处理 LNCaP, PC3 和 BT474M1 细胞,抑制 Akt 底物 PRAS40 磷酸化,IC50 分别为 157 nM, 197 nM, 和 208 nM。而且, GDC-0068 选择性抑制细胞周期进展和 Akt 信号驱动的癌细胞活力, 包括肿瘤抑制基因 PTEN 缺陷,PIK3CA 致癌基因突变, 和 HER2 扩增,在 HER2+和 Luminal 亚型中作用效果最强。
<b>体内研究</b>	GDC-0068 口服处理给药 PC3 前列腺移植瘤模型, 诱导 p-PRAS40 下调。GDC-0068 处理 BT474-Tr 移植瘤,降低 pS6 和 peIF4G 水平,重新定位 FOXO3a 到细胞核,且诱导 HER3 和 pERK 的反馈上调。GDC-0068 处理多种移植瘤模型, 具有有效抗癌活性, 包括 PTEN-缺陷的前列腺癌模型 LNCaP 和 PC3, PIK3CA H1047R 突变的乳腺癌模型 KPL-4, 和 MCF7-neo/HER2 肿瘤模型。

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 href="#">A-674563</a>
MB4498	<a href="#">AT13148</a>
MB3647	<a href="#">AZD5363</a>
MB4497	<a href="#">GSK-2141795,Uprosertib</a>

**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。Ipatasertib (GDC-0068) 是一种选择性, 竞争性的 pan-Akt 抑制剂, 作用于 Akt1, Akt2, Akt3, 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	2.1834 mL	10.9170 mL	21.8341 mL
5 mM	0.4367 mL	2.1834 mL	4.3668 mL
10 mM	0.2183 mL	1.0917 mL	2.1834 mL
50 mM	0.0437 mL	0.2183 mL	0.4367 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 携带 LNCaP, PC3, KPL-4, 或 MCF7 移植瘤的雌性裸鼠
-------------	---

	<b>Formulation:</b> 在 0.5% 甲基纤维素/0.2% Tween-80 中配制 <b>Dosages:</b> ~100 mg/kg/day <b>Administration:</b> 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。