

SAR245409 (XL-765) ; SAR245409 (XL765)

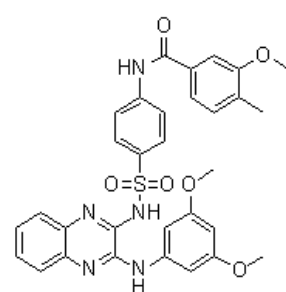
产品编号：MB6028

质量标准：>98%，双重 mTOR/PI3K 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C31H29N5O6S	结 构 式	
分子量	599.66		
CAS No.	1349796-36-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 12 mg/mL (20.01 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：XL765 是双重 mTOR/PI3K 抑制剂,最有效作用于 p110 γ ，IC50 为 9 nM;也抑制 DNA-PK 和 mTOR。PI3K-IN-1 是 PI3K 抑制剂。

别名：N-(4-(N-(3-((3,5-dimethoxyphenyl)amino)quinoxalin-2-yl)sulfamoyl)phenyl)-3-methoxy-4-methylbenzamide

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 12 mg/mL (20.01 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	XL765 是双重 mTOR/PI3K 抑制剂,最有效作用于 p110 γ ，IC50 为 9 nM;也抑制 DNA-PK 和 mTOR。				
靶点	p110 α	p110 β	p110 γ	p110 δ	mTOR
IC50	39 nM	113 nM	9 nM	43 nM	~ 150 nM
体外研究	XL765 是第一个口服的 PI3K 和 mTOR 双重抑制剂，作用于 p110 α , β , γ , δ , 和 mTOR 时 IC50 分别为 39, 113, 9, 43, 和 ~ 150 nM。在体外，XL765 按浓度依赖方式降低细胞活力。				
体内研究	XL765 口服饲喂处理，导致中期肿瘤的下降数，比对照组高 12 倍。XL765 不管是单独作用，还是和其他药物联用作用于各种 GBM 移植瘤，都显示出活性。XL765 作用于体外培养的人类移植瘤，导致 PI3K 下游磷酸化蛋白：pAkt 和 pPRAS40，及 mTOR 下游磷酸化蛋白：pS6 和 p4EBP1 的减量调节。				

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)

MB8065	TG100-115
--------	-----------

MB5302	VS-5584
MB5319	XL-147

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。XL765 是双重 mTOR/PI3K 抑制剂,最有效作用于 p110 γ ,也抑制 DNA-PK 和 mTOR。PI3K-IN-1 是 PI3K 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6676 mL	8.3381 mL	16.6761 mL
5 mM	0.3335 mL	1.6676 mL	3.3352 mL
10 mM	0.1668 mL	0.8338 mL	1.6676 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: 恶性胶质瘤细胞 Concentrations: 10 mM Incubation Time: 72 小时 Method: 细胞接种 24 小时后用 XL765 处理, 24, 48, 或 72 小时后采集细胞用于凋亡或自吞噬试验。细胞凋亡通过荧光激活细胞分选法(FACS)根据膜联蛋白 V 阳性细胞的总百分比测定。酸性自噬泡(AVOs)在 XL765 处理的细胞中通过吖啶橙活体染色检测。AVO 形成的程度以 XL765 处理细胞与对照组细胞相比, 吖啶橙荧光强度(FL3)的增加倍数表示。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 4 到 6 周大的无胸腺 Foxn1nu 裸鼠 Formulation: 10 mM HCl Dosages: 50 mg/kg Administration: 口服饲喂, 每天 2 次。</p>

【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。