

TGX-221; TGX221

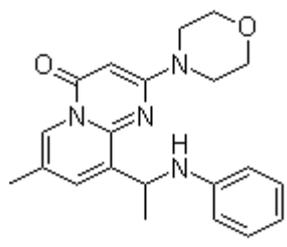
产品编号: MB7274

质量标准: >98%, 特异性的 p110β 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C21H24N4O2	结 构 式	
分子量	364.44		
CAS No.	663619-89-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 12 mg/mL (32.92 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: TGX-221 是一种高效的、选择性的、细胞膜渗透的 PI3K p110β 抑制剂, 常用于癌症治疗。

别名: 4H-Pyrido[1,2-a]pyrimidin-4-one, 7-methyl-2-(4-morpholinyl)-9-[1-(phenylamino)ethyl]-

物理性状及指标:

外观:白色至黄色固体

溶解性:DMSO: 12 mg/mL (32.92 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	TGX-221 是特异性的 p110β 抑制剂, IC50 为 5 nM, 作用于 p110β 比作用于 p110α 选择性高 1000 倍。	
靶点	PI3K p110β	PI3K p110δ
IC50	8.5 nM	211 nM
体外研究	使用重组 p85/p110, 进行体外 PI3K 实验, 测定 TGX-221 作用于不同亚型的活性, TGX-221 有效且高度选择性作用 p110β, 作用于 PI3K p110β 和 PI3K p110δ 时, IC50 分别为 8.5 和 211 nM。而且, TGX-221 作用于 J774.2 巨噬细胞, 局部降低胰岛素诱导的 PKB 在 Ser473 位点磷酸化。TGX-221 作用于体外循环(ECC)模型, 抑制血小板-ECC 相互作用, 血小板凝聚, 和血小板-粒细胞结合。最新研究显示, 用 0.2, 2, 和 20 μM TGX-221 处理 PC3 细胞, 抑制增殖, 且明显降低 p110β PI3K 亚型的活性。	
体内研究	作为抗血栓形成的药剂, TGX-221 按 1+1(49±13.9%) 和 3+3(88±10.6%) 剂量处理小鼠模型,	

	30 分钟后, 提高综合性血流量。此外, TGX-221 按 3+3(平均值 1560)和 1+1 (1305)剂量处理, 提高尾出血时间(BT)和平均肾脏 BT。
特征	TGX-221 是有效的可渗透细胞的 PI3K p110 β 选择性抑制剂

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)

MB3869	GSK2126458 (GSK458)
--------	---------------------

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。TGX-221 是一种高效的、选择性的、细胞膜渗透的 PI3K p110 β 抑制剂, 常用于癌症治疗, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.7439 mL	13.7197 mL	27.4394 mL
5 mM		0.5488 mL	2.7439 mL	5.4879 mL
10 mM		0.2744 mL	1.3720 mL	2.7439 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	脂质激酶活性实验: 使用标准脂质激酶活性, 及 PI 作为底物测定 IC50 值(i)使用 100 μ M 冰冻 ATP 代替 10 μ M, (ii)DMSO 浓度为 1%, (iii)使用 $[\gamma\text{-}^{33}\text{P}]\text{ATP}$ 代替 $[\gamma\text{-}^{32}\text{P}]\text{ATP}$ 。使用感光成像仪扫描测量 TLC 板。使用重组蛋白进行至少三组独立实验, 通过回归曲线分析测定 IC50 值。
细胞实验	Cell lines: PC3 细胞 Concentrations: 0.2 到 20 μ M Incubation Time: 24-72 小时 Method: 测定增殖, 细胞接种在 96 孔培养板上, 重复 2 份, 温育过夜, 使细胞粘附。细胞和 TGX-221 温育 24, 48, 和 72 小时。指定的时间间隔, 通过结晶紫染色比色法量化细胞。加入 100 μ l 2.5% 戊二醛溶液和细胞混合, 然后在室温下温育 30 分钟。板浸泡在 PBS 溶液中洗三次。烘干板, 然后加入 100 μ l 0.1% 溶于去离子水的结晶紫溶液染色, 然后在室温下温育 20 分钟, 用去离子水大面积冲洗, 移除过量染料, 然后烘干板, 然后把染料溶化在 100 μ l 10% 乙酸中。使用酶标仪在 570 nm 处直接测量染料抽提物的光密度。
动物实验	Animal Models: 患 FeCl ₃ 诱导的动脉血栓鼠 Formulation: TGX-221 溶于 10% 乙醇, 10% 樟脑, 10% N,N-二甲基乙酰胺, 70% 蒸馏水 Dosages: 0.3 + 0.3, 1 + 1, 3 + 3 mg/kg + mg/kg/hour Administration: 静脉注射

【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。