

## TG100-115

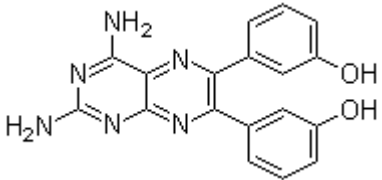
产品编号: MB8065

质量标准: >98%, PI3K $\gamma$ / $\delta$  抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C18H14N6O2	结 构 式	
分子量	346.34		
CAS No.	677297-51-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 9 mg/mL (25.98 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:** TG100-115 是一种选择性的 PI3K $\gamma$ /PI3K $\delta$  抑制剂。

**别名:** Phenol, 3,3'-(2,4-diamino-6,7-pteridinediyl)bis

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

溶解性: .....DMSO: 9 mg/mL (25.98 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>	TG100-115 是一种 PI3K $\gamma$ / $\delta$ 抑制剂, IC <sub>50</sub> 为 83 nM/235 nM, 对 PI3K $\alpha$ / $\beta$ 几乎没有抑制效果。			
<b>特性</b>	TG100-115 是有效的双重 PI3K $\gamma$ / $\delta$ 选择性抑制剂。			
<b>靶点</b>	PI3K $\gamma$ (Cell-free assay) 83 nM	PI3K $\delta$ (Cell-free assay) 235 nM	PI3K $\beta$ (Cell-free assay) 1.2 $\mu$ M	PI3K $\alpha$ (Cell-free assay) 1.3 $\mu$ M
<b>体外研究</b>	TG100-115 抑制 PI3K $\gamma$ 和- $\delta$ 时, IC <sub>50</sub> 分别为 83 和 235 nM。TG100-115 对 PI3K $\alpha$ 和- $\beta$ 抑制效果不明显, IC <sub>50</sub> 分别为 1.2 和 1.3 mM。10 $\mu$ M TG100-115 作用于人脐静脉内皮细胞 (HUVECs), 对细胞增殖和 VEGF 刺激的 ERK 磷酸化都没有作用效果。然而, 10 $\mu$ M TG100-115 阻断其他 VEGF 信号通路, 如 VE-钙粘蛋白磷酸化。10 $\mu$ M TG100-115 作用于 HUVECs, 抑制 VEGF 诱导的 VE 钙粘蛋白整体水平提高。TG100-115 抑制 VEGF 调节的 mTOR 和 p70S6 激酶			

	磷酸化, 这两者都处于 PI3K 下游。125 nM 到 10 $\mu$ M TG100-115 也抑制 FGF 刺激的 Akt 磷酸化。
体内研究	TG100-115 按 1-5 mg/kg 剂量作用于 Miles 实验模型, 降低大鼠的水肿和炎症。TG100-115 按 0.5-5 mg/kg 剂量作用于患心肌梗塞的啮齿目动物和猪模型, 提供有效的心脏保护, 限制梗塞进一步发展, 保存心机功能。[1]TG100-115 按 5 mg/kg 剂量作用于小鼠, 明显降低 Sema3A 或 VEGF 相关的血管通透性, 说明这两种因子可能依赖 PI3K $\gamma$ / $\delta$ 来诱导血管通透性。 [3]TG100-115 作用于患哮喘鼠模型, 明显降低嗜酸性粒细胞增多症, 抑制白细胞介素 13 和粘蛋白积累。

**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)**

MB3879	AS-605240
MB3572	CAY10505
MB5316	CZC24832

**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。TG100-115 是一种选择性的 PI3K $\gamma$ /PI3K $\delta$  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	2.8873 mL	14.4367 mL	28.8734 mL
5 mM	0.5775 mL	2.8873 mL	5.7747 mL
10 mM	0.2887 mL	1.4437 mL	2.8873 mL
50 mM	-	-	-

**经典实验操作 (仅供参考)**

激酶实验	PI3K 实验: 40 mL 含 50 mM D-肌肉-磷脂酰环己六醇 4,5-二磷酸底物和 PI3K 亚型的反应 buffer(20 mM Tris/4 mM MgCl <sub>2</sub> /10 mM NaCl, pH 7.4)等分到 96 孔板上, 每孔激酶浓度为 250-500 ng, 反应 90 分钟后, 获得线性动力学。然后加入 2.5 mL TG100-115, DMSO 终浓度为 100 mM 到 1 nM。加入 10 mL ATP 开始反应, 终浓度为 3 mM, 90 分钟后, 加入 50 mL Kinase-Glo 试剂, 测量残留的 ATP 水平;使用 Ultra 384 仪测发光度。通过非线性曲线拟合使用 Prism Version 4 测定 IC <sub>50</sub> 值。
细胞实验	Cell lines: 人脐静脉内皮细胞(HUVECs) Concentrations: 10 $\mu$ M, 溶于 DMSO, 作为储存溶液 Incubation Time: 24,48,和 72 小时 Method: 细胞按每孔 5 $\times$ 10 <sup>3</sup> 个细胞接种在 96 孔板上, 培养在实验培养基(含 0.5%血清和 50 ng/mlVEGF)上, 在有或无 TG100-115 存在时,通过 XTT 实验进行 24,48,或 72 小时测定细胞数。
动物实验	Animal Models: 患心肌缺血(MI)Sprague-Dawley 鼠

Formulation: 溶于 PEG 或磺丁基醚-β-环糊精 Dosages: 0.5-5 mg/kg 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。