

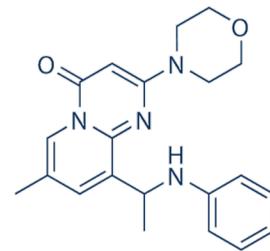
## TGX221 (PI3K抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2802-10mM	TGX221 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2802-5mg	TGX221 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2802-25mg	TGX221 (PI3K抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	9-(1-anilinoethyl)-7-methyl-2-morpholin-4-ylpyrido[1,2-a]pyrimidin-4-one
简称	TGX221
别名	TGX 221, TGX-221, TGX221 cpd
中文名	N/A
化学式	C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>
分子量	364.44
CAS号	663619-89-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 12mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.37ml DMSO, 或每3.64mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2802-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	TGX-221是一种p110β-特定的抑制剂, 在无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为5nM, 作用于p110β的选择性是作用于p110α的1000倍。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	p110β	p110δ	p110α	p110γ	C2α
IC <sub>50</sub>	5nM	0.1μM	5μM	>10μM	>10μM
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, IC <sub>50</sub> 分别为8.5和211nM。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20μM 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。				
临床实验	N/A				
特征	TGX-221是有效的可渗透细胞的PI3K p110β选择性抑制剂。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	使用标准脂质激酶活性, 及PI作为底物测定IC <sub>50</sub> 值(i)使用100μM冰冻ATP代替10μM, (ii)DMSO浓度为1%, (iii)使用[γ-33P]ATP代替[γ-32P]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IC <sub>50</sub> 值。

细胞实验	
细胞系	PC3细胞
浓度	0.2到20μM
处理时间	24-72小时
方法	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100μl 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100µl 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100µl 10%乙酸中。使用酶标仪在570nm处直接测量染料抽提物的光密度。
--	--

动物实验	
动物模型	患FeCl3诱导的动脉血栓鼠
配制	TGX-221溶于10%乙醇，10%樟脑，10% N,N-二甲基乙酰胺，70%蒸馏水
剂量	0.3+0.3, 1+1, 3+3mg/kg/hour
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

1. Chaussade C, et al. Biochem J. 2007, 404(3), 449-458.
2. Straub A, et al. Thromb Haemost. 2008, 99(3), 609-615.
3. Lu XY, et al. Appl Microbiol Biotechnol. 2011, 89(5), 1423-1433.
4. Bird JE, et al. Thromb Res. 2011, 127(6), 560-564.
5. Jackson SP, et al. Nat Med. 2005, 11(5), 507-514.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF2802-10mM	TGX221 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2802-5mg	TGX221 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2802-25mg	TGX221 (PI3K抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01