

TGX221

产品信息

产品名称	产品编号	规格
TGX221	53721ES08	5 mg
	53721ES25	25 mg

产品描述

TGX221 (TGX-221)是细胞可渗透的 PI3K p110 β 选择性抑制剂, IC₅₀为 5 nM, 可用为抗血栓形成的药物, 具有潜在的抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	TGX221, TGX-221
靶点 (Target)	p110 β
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--PI3K
CAS 号 (CAS NO.)	663619-89-4
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₂₄ N ₄ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	364.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

TGX-221 (1 μM)不影响 C2C12 成肌细胞中 AMPK 的表达和磷酸化。TGX221 (0.1-10μM)诱导 ASM 细胞释放 IL-6。^[2] 当单独使用时, TGX-221 不影响神经降压素刺激的 Akt 磷酸化, 但当与吉非替尼组合时, 它进一步抑制神经降压素刺激的 Akt 磷酸化。TGX-221 消除 Panc-1 细胞中神经降压素刺激的 Akt 磷酸化。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在动脉血栓大鼠模型中, 静脉注射 TGX-221 (2.5 mg/kg)可消除血栓形成的 Folts 样颈动脉狭窄制剂中的循环流量减少, 而不会改变出血时间、心率、血压或颈动脉血管电导。^[4]

参考文献

- [1]. Zhao Y, et al. Prodrug strategy for PSMA-targeted delivery of TGX-221 to prostate cancer cells. Mol Pharm. 2012 Jun 4;9(6):1705-16.
- [2]. Ge Q, et al. The phosphoinositide 3'-kinase p110 δ modulates contractile protein production and IL-6 release in human airway smooth muscle. J Cell Physiol. 2012 Aug;227(8):3044-52.
- [3]. Müller KM, et al. Role of protein kinase C and epidermal growth factor receptor signalling in growth stimulation by neurotensin in colon carcinoma cells. BMC Cancer. 2011 Oct 2;11:421.
- [4]. Sturgeon SA, et al. Advantages of a selective beta-isoform phosphoinositide 3-kinase antagonist, an anti-thrombotic agent devoid of other cardiovascular actions in the rat. Eur J Pharmacol. 2008 Jun 10;587(1-3):209-15.
- [5]. Chaussade C, et al. Evidence for functional redundancy of class IA PI3K isoforms in insulin signalling. Biochem J. 2007 Jun 15;404(3):449-58.