

Apitolisib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Apitolisib	53892ES08	5 mg

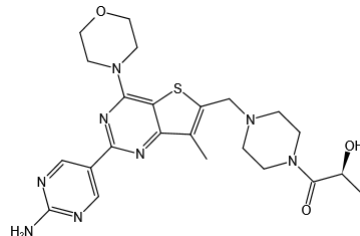
产品描述

Apitolisib (GDC-0980, RG7422, GNE 390, GDC0980, RG-7422, GNE390)是口服的 I 类 PI3K 选择性抑制剂，作用于 PI3K $\alpha/\beta/\delta/\gamma$ 的 IC₅₀ 分别为 5 nM、27 nM、7 nM 和 14 nM，具有抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Apitolisib, GDC-0980, RG7422, GNE 390, GDC0980, RG-7422, GNE390
靶点 (Target)	PI3K
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--PI3K
CAS 号 (CAS NO.)	1032754-93-0
分子式 (Formula)	C ₂₃ H ₃₀ N ₈ O ₃ S
分子量 (Molecular Weight)	498.60
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

1. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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）

在 PC3 和 MCF7 细胞中，Apitolisib 抑制细胞增殖，IC₅₀ 分别为 307 nM 和 255 nM。^[1] GDC-0980 通过抑制细胞周期进

程, 诱导细胞凋亡降低癌细胞活性。^[2]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 PC3 和 MCF7 异种移植瘤小鼠中, 口服 Apitolisib (1 mg/kg) 引起肿瘤生长延迟。^[1]

参考文献

[1] Sutherlin DP, et al. Discovery of a potent, selective, and orally available class I phosphatidylinositol 3-kinase (PI3K)/mammalian target of rapamycin (mTOR) kinase inhibitor (GDC-0980) for the treatment of cancer. *J Med Chem.* 2011 Nov 10;54(21):7579-87.

[2] Wallin JJ, et al. GDC-0980 is a novel class I PI3K/mTOR kinase inhibitor with robust activity in cancer models driven by the PI3K pathway. *Mol Cancer Ther.* 2011 Dec;10(12):2426-36.