

HB211207

GDC-0068(Ipatasertib; RG7440; GDC0068)

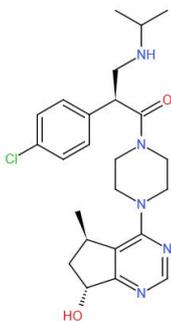
产品信息

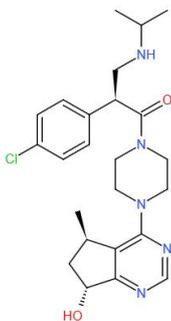
产品名称	产品编号	规格
	53009ES03	1 mg
GDC-0068(Ipatasertib; RG7440; GDC0068)	53009ES08	5 mg
	53009ES10	10 mg

产品描述

GDC-0068 是一种 ATP 竞争型的高效选择性的 PAN-AKT 抑制剂, 其抑制 Akt 1/2/3 的 IC₅₀ 值分别是 5 nM、18 nM、8 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Ipatasertib; RG7440; GDC0068; CS0975
中文名称 (Chinese Name)	帕他色替
靶点 (Target)	Akt 1; Akt 2; Akt 3
CAS 号 (CAS NO.)	1001264-89-6
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₃₂ ClN ₅ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	458
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℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃避光保存, 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) 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）

GDC-0068 (1, 5, 10 $\mu\text{mol/L}$) 处理细胞 24 h、48 h、72 h 后检测细胞增殖情况，GDC-0068 阻断 Akt 信号通路，在癌细胞系中具有抗增殖和诱导凋亡作用。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

GDC-0068 (0, 12.5, 50, 100 mg/kg) 处理移植瘤模型，24 h 后检测 MCF7-neo/HER2 肿瘤组织中 Akt、PRAS40 和 S6 的磷酸化水平，GDC-0068 在 PTEN 缺失、PIK3CA 突变或 HER2 过表达等基因改变的异种移植模型中，可以有效激活 Akt 信号通路。在这些模型中，在不大于 100 mg/kg 的每日口服剂量下，肿瘤出现生长延迟、停滞或消退等现象。^[1]

参考文献

- [1]. Lin J, et al. Targeting activated Akt with GDC-0068, a novel selective Akt inhibitor that is efficacious in multiple tumor models. Clin Cancer Res. 2013 Apr 1;19(7):1760-72.
- [2]. Blake JF, et al. Discovery and preclinical pharmacology of a selective ATP-competitive Akt inhibitor (GDC-0068) for the treatment of human tumors. J Med Chem. 2012 Sep 27;55(18):8110-27.