

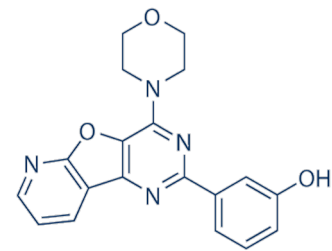
PI-103 (PI3K抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2690-10mM	PI-103 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2690-5mg	PI-103 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2690-25mg	PI-103 (PI3K抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-(4-morpholin-4-ylpyrido[2,3]furo[2,4-b]pyrimidin-2-yl)phenol
简称	PI-103
别名	PI 103, PI103
中文名	N/A
化学式	C ₁₉ H ₁₆ N ₄ O ₃
分子量	348.36
CAS号	371935-74-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 24mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.44ml DMSO, 或每3.48mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2690-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	PI-103是一种多靶点PI3K抑制剂, 在无细胞试验中作用于p110α/β/δ/γ的IC ₅₀ 为2nM/3nM/3nM/15nM, 对mTOR/DNA-PK的作用较小, IC ₅₀ 为30nM/23nM。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	p110α	p110β	p110δ	p110γ	DNA-PK
IC ₅₀	2nM	3nM	3nM	15nM	23nM
体外研究	PI-103有效抑制蛋白激酶mTOR的对apamycin敏感的(mTORC1)和对rapamycin不敏感的(mTORC2)复合物。PI-103是第三大靶点PI3K抑制剂。PI-103抑制组成型和生长因子诱导的PI3K/Akt和mTORC1激活。在胚细胞中, 尤其在白血病干细胞中, PI-103抑制白血病细胞增殖和白血病前体细胞形成集落, 且诱导线粒体细胞凋亡。PI-103抑制p110α的效果比抑制p110β强200倍以上。PI-103也有效抑制脂肪细胞中的PI(3,4)P ₂ 和PIP ₃ , 及肌管中的PIP ₃ 。与LY294002抑制Akt磷酸化的IC ₅₀ 值相比, PI-103抑制Akt磷酸化的IC ₅₀ 值要低到100倍。PI-103保护动物使其免受胰岛素刺激而导致的血糖降低。PI-103和etoposide联用作用于胚细胞和不成熟的白血病细胞有增强凋亡的功效。				
体内研究	当肿瘤达到50-100mM ³ 时, 动物随机分组, 用PI-103处理, 及空白对照处理。PI-103具有明显活性, 处理18天后, 使肿瘤平均尺寸降低4倍。用PI-103处理的鼠在发病前或验尸时没有明显毒性现象(根据体重、食物和水摄取情况、活动性及常规检查)。处理的肿瘤Akt和S6磷酸化水平明显降低, 伴随着p110α和mTOR被抑制。PI-103处理神经胶质移植瘤, 抑制生长。				
临床实验	N/A				
特征	PI-103是第一个有效合成的mTOR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	加入含10μCi γ-32P-ATP的ATP开始反应, 终浓度为10或100μM, 在室温下进行20分钟。用于分析TLC, 加入105μl 1N HCl, 然后加入160μl CHCl ₃ :MeOH(1:1), 反应终止。涡旋两相混合物, 简单离心, 使用CHCl ₃ 预包装的凝胶上样吸头将有机相转移到新的试管中。TLC板上染色提取物, 然后在n-丙醇:1M乙酸的溶液中进行3到4小时。然后烘干TLC板, 然后用感光成像系统处理, 再进行量化。测定PI-103, 用10-12种浓度从实验所用最高浓度(100μM)稀释2倍的抑制剂进行激酶活性测定。测定IC ₅₀ 重复进行2到4次, 取几次独立测量的平均值。

细胞实验	
细胞系	U87MG细胞
浓度	0.5 μ M
处理时间	24小时
方法	评估细胞死亡，用PI-103处理U87MG细胞24小时。通过LDH活性的比色测定，用细胞毒性检测试剂盒测量细胞死亡。按公式： $[(\text{实验值}-\text{低对照值})/(\text{高对照值}-\text{低对照值})\times 100]$ 计算死亡百分率(3个12孔板每个实验点的平均值)，低对照细胞用DMSO处理的，高对照细胞用1% Triton X-100在37 $^{\circ}$ C下处理30分钟。

动物实验	
动物模型	左前肢末端皮下注射U87MG:10 ⁶ 个 Δ EGFR细胞的6到12周大Balbc nu/nu鼠
配制	50% DMSO
剂量	5mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Knight ZA, et al. Cell, 2006, 125(4), 733-747.
- 2.Fan QW, et al. Cancer Cell, 2006, 9(5), 341-349.
- 3.Raynaud FI, et al. Mol Cancer Ther. 2009, 8(7), 1725-1738.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF2690-10mM	PI-103 (PI3K抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SF2690-5mg	PI-103 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2690-25mg	PI-103 (PI3K抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 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的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