

BAY 80-6946

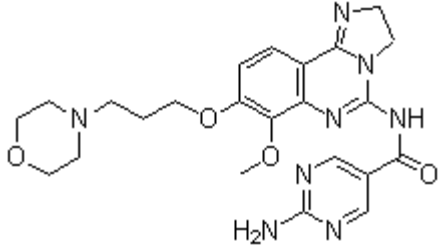
产品编号：MB3571

质量标准：>98%，可逆 PI3K α / β 抑制剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C23H28N8O4	结构式	
分子量	480.52		
CAS No.	1032568-63-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
	6月-80°C 溶于 DMSO		
溶解性 (25°C)	DMSO : 0.002 mg/mL (0.0 mM)		
	10% Trifluoroacetic acid water solution : 1 mg/mL (2.08 mM)		
	Ethanol : 0.01 mg/mL (0.02 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：库潘尼西 BAY 80-6946 是一种 ATP 竞争，选择性 I 型 PI3 激酶抑制剂，作用于 PI3K α ，PI3K δ ，PI3K β 和 PI3K γ 的 IC₅₀ 分别为 0.5，0.7，3.7 和 6.4 nM。

别名：5-Pyrimidinecarboxamide,

2-amino-N-[2,3-dihydro-7-methoxy-8-[3-(4-morpholinyl)propoxy]imidazo[1,2-c]quinazolin-5-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....灰白色到棕色粉末

溶解性：.....DMSO : 0.002 mg/mL (0.0 mM) ; 10% Trifluoroacetic acid water solution : 1 mg/mL (2.08 mM) ; Ethanol : 0.01 mg/mL (0.02 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Copanlisib (BAY 80-6946)是一个高效的泛I型 PI3K 抑制剂 其对 PI3K α / β / γ / δ 抑制的 IC50 分别为 0.5, 3.7, 6.4, and 0.7 nM。Phase 3。			
靶点	PI3K α (Cell-free assay)	PI3K δ (Cell-free assay)	PI3K β (Cell-free assay)	PI3K γ (Cell-free assay)
	0.5 nM	0.7 nM	3.7 nM	6.4 nM
体外研究	BAY 80-6946 是 PI3K 抑制剂 具有抗肿瘤活性。BAY 86-9766 抑制 HuCCT-1 (KRAS ^{G12D}) 和 EGI-1 (KRAS ^{G12D}) 细胞系增殖，IC50 分别为 147 nM 和 137 nM。			

体内研究	BAY 80-6946 耐受性良好, MTD(最大耐受剂量)为 0.8 mg/kg。PK (药代动力学) 研究结果支持每周给药。按 MTD 处理, 在第一个 24 小时期间出现 2/3 级高血糖。PK, 临床 SD 和 FDG-PET 数据与有效处理和 PI3K 通路抑制情况一致。
-------------	---

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4505	740Y-P
MB3878	AS-252424
MB5532	BYL719
MB3572	CAY10505
MB3881	PIK-90

用途及描述 : 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。BAY 80-6946 是一种具有潜在抗肿瘤活性的磷酸肌苷 3-激酶(PI3K)抑制剂。PI3K inhibitor BAY 80-6946 抑制 PI3K 信号通路的激活, 可能抑制肿瘤细胞的生长和易感肿瘤细胞群的生存。PI3K 信号通路的激活常常与肿瘤的发生有关, PI3K 信号通路的失调可能有助于肿瘤对多种抗肿瘤药物的耐受。

储液配置

体 (10% TFA (aq)) 量 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0811 mL	10.4054 mL	20.8108 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	<p>PI3Kα 和 PI3Kβ 放射性脂质激酶检测:</p> <p>p110α 生化检测是一种放射性测定, 测量 ³³P 渗透进 p110α 底物磷脂酰肌醇 (PI) 的程度。His 标记的 N-末端截短的(ΔN 1-108) p110α 和同样截短的缺乏 p85 结合域的 p110β(ΔN 1-108) 蛋白在 Sf9 细胞中表达, 且纯化到 50%以上纯度。为了获得 IC50 值, 使用 MaxiSorp 板在以下条件下在 384 孔板中进行反应。每孔使用 2 μg 在氯仿稀释的摩尔比为 1:1 的磷脂酰肌醇 (PI) 和磷脂酰丝氨酸 (PS) 包被实验板。将实验板置于通风橱中过夜, 蒸发有机溶液。将实验板密封在 4$^{\circ}$C 贮存 1 个月。每孔加入 7.5 ng 截短的 p110α 蛋白, 每孔中含 9 μL 实验 buffer (50mM MOPSO pH 7.0, 100 mM NaCl, 4mM MgCl₂, 0.1%(w/v)BSA), 除了对照组只含实验 buffer。1μL 溶于 DMSO 的实验化合物从稀释液中转移, 获得 8 点剂量反应 (0.0, 0.003, 0.01, 0.03, 0.1, 0.3, 1.0, 3.0 和 10 μM 终浓度 BAY 化合物)。加入含 20 μCi/mL [γ-³³P]-ATP 的 40 μM ATP 溶液开始反应, 反应在室温下温和混合进行 2 小时。加入 5μL 25 mM EDTA 储存液终止反应。不使用洗涤剂清洗实验板, 而使用 384 孔实验板洗涤器, 然后每孔加入 25μL UltimaGold 闪烁使用 BetaPlate 液体闪烁计数器测定渗透进固定化 PI 底物的放射性。</p>
细胞实验 :	<p>Cell lines: KPL4, BT474, T47D, BT20, MCF7, MDA-MB-468, SK-Br-3, LNCaP, PC3, Colo205, HT29, HCT116, A549, H460, U87MG, 786O.</p> <p>Concentrations: 0.0, 0.003, 0.01, 0.03, 0.1, 0.3, 1.0, 3.0 和 10 μM</p>

	<p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 药物处理 72 小时后，使用 Cell Titer-Glo 发光法细胞活力检测试剂盒测定细胞增殖。细胞按每孔 500-1000 个细胞接种到 384 孔板中，孔中含 25 μL 生长培养基。对于每种细胞系的测定，细胞接种到单独的实验板上，在 t=0 小时和 t=72 小时测定发光值。在 37°C 下温育过夜，每孔加入 25μL Cell Titer-Glo 溶液测定 t=0 时样品的发光值，转移实验板到摇床上，在室温下进行 10 分钟，然后使用发光检测仪(最大光检测在 428 nm 处测定)在 Wallac Victor2 1420 Multilable HTS 计数板上对实验板进行读数。使用在生长培养基中稀释的化合物(终体积为 30 μL)处理 t=72 小时的剂量板。细胞在 37°C 下温育 72 小时。每孔加入 30μL Cell Titer-Glo 溶液测定 t=72 小时样品的发光值，然后将细胞置于摇床上在室温下进行 10 分钟，然后使用 Victor 发光检测仪读取发光值。进行数据处理，实验组和对照组中 t=72 小时发光值减去 t=0 时发光值。实验组和对照组的发光值百分比差异用来测定生长抑制百分数。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: Rats bearing KPL4 or HCT116 xenografts</p> <p>Formulation: PEG400/acidified water (0.1 N HCl, pH 3.5; 20/80, v/v) or 5% mannitol</p> <p>Dosages: 6 mg/kg</p> <p>Administration: i.v.</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。