

PI103 ; PI-103

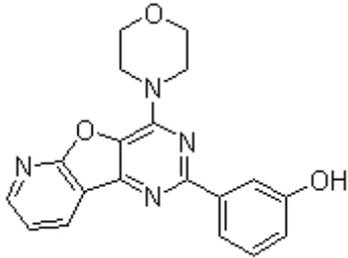
产品编号 : MB3864

质量标准 : >98%,有效的多靶点的 PI3K 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C19H16N4O3	结 构 式	
分子量	348.36		
CAS No.	371935-74-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 24 mg/mL (68.89 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
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: PI-103 是一种多靶点抑制剂, 抑制 p110 α , p110 β , p110 δ , p110 γ , mTORC1 和 mTORC2 等。

别名: 3-(4-(4-Morpholinyl)pyrido[3',2':4,5]furo[3,2-d]pyrimidin-2-yl)phenol, mTOR Inhibitor V, PI 3-K Inhibitor V

物理性状及指标:

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 24 mg/mL (68.89 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

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	PI-103 是一种多靶点 PI3K 抑制剂, 在无细胞试验中作用于 p110 α / β / δ / γ 的 IC ₅₀ 为 2 nM/3 nM/3 nM/15 nM, 对 mTOR/DNA-PK 的作用较小, IC ₅₀ 为 30 nM/23 nM。				
特性	PI-103 是第一个有效合成的 mTOR 抑制剂。				
靶点	p110 α (Cell-free assay)	p110 β (Cell-free assay)	p110 δ (Cell-free assay)	p110 γ (Cell-free assay)	DNA-PK (Cell-free assay)
	2 nM	3 nM	3 nM	15 nM	23 nM
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 是第三大多靶点 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 p110 α 的效果比抑制 p110 β 强 200 倍以上。PI-103 也有效抑制脂肪细胞中的 PI(3,4)P2 和 PIP3, 及肌管中的 PIP3。与				

	LY294002 抑制 Akt 磷酸化的 IC50 值相比, PI-103 抑制 Akt 磷酸化的 IC50 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 50-100 mm 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 p110 α 和 mTOR 被抑制。PI-103 处理神经胶质移植瘤, 抑制生长。

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)

MB3888	BGT226 (NVP-BGT226)
MB5532	BYL719
MB3572	CAY10505

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。本品 PI-103 是一种有效的 PI3K 和 mTOR 抑制剂, 抑制 p110 α , p110 β , p110 δ , p110 γ , mTORC1 和 mTORC2, PI-103 还抑制 DNA-PK。

可用于相关领域的科研实验。

储液配置

浓度	质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8706 mL	14.3530 mL	28.7059 mL
5 mM	0.5741 mL	2.8706 mL	5.7412 mL
10 mM	0.2871 mL	1.4353 mL	2.8706 mL
50 mM	0.0574 mL	0.2871 mL	0.5741 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>p110 激酶实验:</p> <p>加入含 10 μCi γ-32P-ATP 的 ATP 开始反应, 终浓度为 10 或 100 μM, 在室温下进行 20 分钟。用于分析 TLC, 加入 105 μL 1 N HCl, 然后加入 160 μL CHCl₃:MeOH (1:1), 反应终止。涡旋两相混合物, 简单离心, 使用 CHCl₃ 预包被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:1 M 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 (100 μM) 稀释 2 倍的抑制剂进行激酶活性测定。测定 IC₅₀ 重复进行 2 到 4 次, 取几次独立测量的平均值。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: U87MG 细胞</p> <p>Concentrations: 0.5 μM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method: 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: [(实验值-低对照值)/(高对照值-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。</p>
动物实验:	<p>Animal Models: 左前肢末端皮下注射 U87MG:106 个 ΔEGFR 细胞的 6 到 12 周大</p>

	Balbc nu/nu 鼠 Formulation: 50% DMSO Dosages: 5 mg/kg Administration: 腹腔注射
--	--

【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。如需制备储备液，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。