PIK75；PIK-75

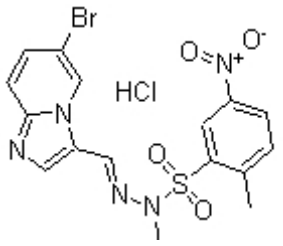
产品编号：MB3867

质量标准：>98%，有效的 p110α 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C16H14BrN5O4S.HCl	结构式	
分子量	488.74		
CAS No.	372196-77-5		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：4 mg/mL warmed (8.18 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：PIK-75 是 p110α 抑制剂，也有效抑制 DNA-PK。

别名：PIK-75 Hydrochloride; PIK 75;2-Methyl-5-nitrobenzenesulfonic acid [(6-bromoimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)methylene]methylhydrazide hydrochloride

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：4 mg/mL warmed (8.18 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PIK-75 是 p110α 抑制剂 ,IC50 为 5.8 nM (比作用于 p110β 效果高 200 倍), 也有效抑制 DNA-PK，IC50 为 2 nM。			
靶点	DNA-PK (Cell-free assay)	p110α (Cell-free assay)	p110γ (Cell-free assay)	p110δ (Cell-free assay)
IC50	2 nM	5.8 nM	76 nM	0.51 μM
体外研究	与纯化的 p110α 结合, PIK-75 是非竞争性抑制剂，Ki 为 36 nM。PIK-75 也有效抑制 DNA-PK，IC50 为 2 nM。PIK-75 (1 μM) 通过显著降低无刺激的非哮喘气道平滑肌细胞（ASM），哮喘 ASM 细胞，和肺成纤维细胞的线粒体活性，降低细胞寿命。PIK75 作用于 TGFβ 刺激的 ASM 细胞, 只降低哮喘细胞中的线粒体活性 ,而对非哮喘细胞没有作用效果。最新研究显示 PIK-75 (10 nM)作用于气道平滑肌细胞（ASM），抑制 TNF-α 诱导的 CD38 mRNA 表达，且显著降低 TNF-α 诱导的 ADP-核糖环化酶活性。			
体内研究	PIK-75 作用于 ErbB3WT 肿瘤模型，降低 HRGβ1 趋化反应，且降低 40% pAkt 水平。此外, PIK-75 作用于 ErbB3WT 原发性肿瘤，显著降低肿瘤细胞运动，和入侵。			

	PIK-75 作用于 CD1 雄鼠，导致胰岛素耐量试验（ITT）和糖耐量试验（GTT）严重损伤，且在丙酮酸糖耐量试验（PTT）期间糖产量提高。

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。PIK-75 是 p110α 抑制剂，比作用于 p110β 效果高 200 倍, 也有效抑制 DNA-PK。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0461 mL	10.2304 mL	20.4608 mL
5 mM	0.4092 mL	2.0461 mL	4.0922 mL
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	**抑制实验:** PI3K 抑制剂 PIK-75 溶于 10 mM DMSO，然后储存于−20°C。在 50 μL 20 mM HEPES, pH 7.5, 和 5 mM $MgCl_2$，180 μM 磷脂酰肌醇的混合物中测定 PI3K 酶活性，加入 100 μM ATP (含 2.5 μCi [γ-^{32}P]ATP)开始反应。在室温下温育 30 分钟，通过加入 50 μL of 1 M HCl 终止酶反应。使用 100 μL 氯仿/甲醇[1:1 (v/v)] 和 250 μL 2 M KCl 抽提磷脂，然后使用液体闪烁计数器计数。抑制剂在 20% (v/v) DMSO 中稀释，然后获得浓度对酶活性抑制曲线，使用 Prism version 5.00 用于 Windows 系统分析，计算 IC50 曲线。动力学分析中，使用荧光实验测定 ATP 消耗。在 50 μL 20 mM HEPES, pH 7.5, 和 5 mM $MgCl_2$，PI 及不同浓度 ATP 中，测定 PI3K 酶活性。在室温下温育 60 分钟后，加入 50 μL Kinase-Glo 终止反应，然后再温育 15 分钟。使用 Fluostar 酶标仪测定光值。使用 Prism 分析结果。
细胞实验：	**Cell lines:** A2780, A2780/cp70, 2780AD, HCT116, HT29, WIL, CALU-3, MCF7, PC3 和 HS852 **Concentrations:** 0 到 10 μM **Incubation Time:** 48 小时 **Method:** TGFβ 刺激后，通过 MTT 实验测定线粒体活性。收集冲洗的细胞再悬浮在 DMEM-l0% FCS 中，等分(500 μL) 装到 24 孔板中，然后连续稀释 (1:2) 。细胞稀释后，每孔立即加入 100 μL 合适浓度 MTT(溶于 PBS，通过 0.2 μm 过滤器过滤，用于移动任何蓝色甲臜产品)，然后在 37°C 下温育 3.5 小时。通过在每孔 0.01 M HCl 中加入 500 μL 10% SDS ，产生的甲臜溶液在 37°C 下再过夜（16 小时）溶解。重复孔中的样本(150 μL)转移到 96 孔板上，使用分光光度计自动测定作用于空白试剂（无细胞）的光密度。在实验波长为 570 nm 处，参考波长为 690 nm 处测定吸光值。测定每组原代培养细胞，取 3 到 6 个孔的平均值，数据表示为 570 到 690 nm 处吸光值。

动物实验：	**Animal Models:** 右四乳腺脂肪垫注射 MTLn3 细胞的雌性严重联合免疫缺陷/NCR 小鼠 **Formulation:** PIK-75 PIK-75 溶于 DMSO，然后在 PBS 中稀释 **Dosages:** ≤1 μM **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。