

## VS-5584 ; VS5584

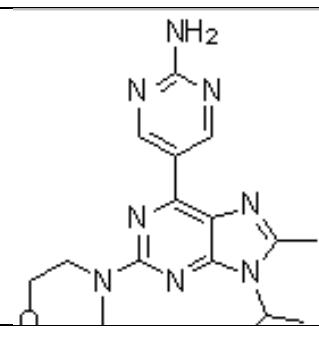
产品编号 : MB5302

质量标准 : >98%,PI3K/mTOR 双重抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C17H22N8O	结 构 式	
分子量	354.41		
CAS No.	1246560-33-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 71 mg/mL (200.33 mM) Water : Insoluble Ethanol : 3 mg/mL (8.46 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 :** VS-5584 是一种 PI3K/mTOR 激酶抑制剂。

**别名 :** SB2343 ; 2-Pyrimidinamine, 5-[8-methyl-9-(1-methylethyl)-2-(4-morpholinyl)-9H-purin-6-yl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 71 mg/mL (200.33 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 3 mg/mL (8.46 mM)

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	VS-5584 (SB2343)是一种有效的, 选择性, PI3K/mTOR 双重抑制剂, 抑制 mTOR 和 PI3K $\alpha/\beta/\delta/\gamma$ , IC50 分别为 3.4 nM 和 2.6-21 nM。Phase 1。				
<b>靶点</b>	PI3K $\alpha$	PI3K $\delta$	PI3K $\gamma$	mTOR	PI3K $\beta$
	2.6 nM	2.7 nM	3.0 nM	3.4 nM	21 nM
<b>体外研究</b>	VS-5584 是 ATP 竞争性抑制剂, 选择性抑制 PI3K/mTOR 信号通路, 作用效果和抑制所有人				

	PI3K 的亚型和 mTOR 激酶相当。VS-5584 对 HMLE 乳腺癌细胞的选择性高于癌症干细胞约 10 倍，EC50 值是 15 nM。VS-5584 优先降低 HMLER 永生乳腺癌细胞系中 CD44 <sup>hi</sup> /CD24 <sup>lo</sup> 细胞量。在 SUM159 细胞中，VS-5584 有效地减少癌干细胞侧群。大量人类癌症细胞系（436 株）表现广泛的抗增殖敏感性，含 PI3KCA 突变的细胞通常对 VS-5584 治疗更敏感。在 FLT3-ITD 突变的 MV4-11 细胞中，VS-5584 抑制了 pAkt (S473) 和 pAKT (T308)，IC50 分别为 12 nM 和 13 nM。VS-5584 抑制 pS6 (S240/244), pAkt (S473) 和 pAkt (T308)，IC50 分别是 20 nM，23 nM，和 15 nM。
<b>体内研究</b>	在三阴性乳腺癌的小鼠中，VS-5584 的口服剂量减少肿瘤干细胞，并诱导紫杉烷抗性的模型中肿瘤消退。在 PTEN <sup>null</sup> 人前列腺癌 PC3 异种移植模型中，VS-5584 在 11 毫克/千克和 25 毫克/千克时导致显著肿瘤生长抑制（TGI），抑制率分别为 79% 和 113%。在 FLT3-ITD AML 移植瘤模型中，VS-5584 治疗诱导剂量依赖性抑制肿瘤生长（3.7 毫克/千克时为 28% 和 11 毫克/千克时为 76%）。

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)

MB7303	GW501516
MB4844	L-165041
MB3812	T0070907

**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。VS-5584 是一种 PI3K/mTOR 激酶抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8216 mL	14.1080 mL	28.2159 mL
5 mM	0.5643 mL	2.8216 mL	5.6432 mL
10 mM	0.2822 mL	1.4108 mL	2.8216 mL
50 mM	0.0564 mL	0.2822 mL	0.5643 mL

#### 经典实验操作（仅供参考）

<b>激酶实验</b>	<p><b>体外 mTOR 激酶测定：</b></p> 反应混合物是由含有下列成分的 10 $\mu$ L 的测定缓冲液组成 (50 mM Hepes pH 7.5, 10 mM 氯化镁, 3 mM 氯化锰, 1 mM EGTA, 2 mM DTT, 0.01%吐温 20)：自制的 0.10 微克/毫升的 mTOR 酶, 0.05 $\mu$ M ULight-eIF4E-结合蛋白 1 (Thr37/46) 和 10 $\mu$ M ATP。将混合物室温温育 60 分钟。10 $\mu$ L 检测混合物包括 16 mM EDTA, 0.004mM Eu-W1024-标记的抗磷酸化的 eIF4E 结合蛋白 1- (Thr37/46) 抗体和 1X 的 LANCE®检测缓冲液，然后加入温育
-------------	---

	60 分钟。
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> SNU-478, SNU-1196, SNU-245, SNU-1079, SNU-308 和 SNU-869</p> <p><b>Concentrations:</b> ~10 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> CellTiter 格洛分析 (Only for Reference)</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 雄性 ( PC3 和 COLO205 ) 或雌性 ( MV4-11 和的 HuH7 ) 的 BALB/c 裸小鼠或雌性 SCID 小鼠 ( NCI-N87 ) 。</p> <p><b>Formulation:</b> 0.5% 甲基纤维素 ( W / V ) 和 0.1% 吐温 80 溶解在水中</p> <p><b>Dosages:</b> 11 毫克/千克, 25 毫克/千克 每天一次</p> <p><b>Administration:</b> 口服 (Only for Reference)</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，否则会严重影响化合物活性，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。