

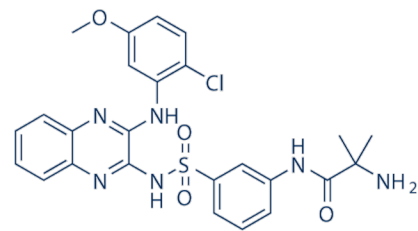
## Pilaralisib (PI3K抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2775-10mM	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2775-5mg	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	5mg
SF2775-25mg	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-amino-N-[3-[[3-(2-chloro-5-methoxyanilino)quinoxalin-2-yl]sulfonyl]phenyl]-2-methylpropanamide
简称	Pilaralisib
别名	XL147, SAR 245408, SAR245408, XL 147, XL-147
中文名	N/A
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>6</sub> O <sub>4</sub> S
分子量	541.02
CAS号	934526-89-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.92ml DMSO, 或每5.41mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2775-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Pilaralisib (XL147)是一种选择性的可逆I型PI3K抑制剂, 作用于PI3K $\alpha/\delta/\gamma$ , 在无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为39nM/36nM/23nM, 对PI3K $\beta$ 作用较低。Phase 1/2。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	PI3K $\gamma$	PI3K $\beta$	PI3K $\delta$	PI3K $\alpha$	—
IC <sub>50</sub>	23nM	36nM	36nM	39nM	—
体外研究	Pilaralisib在儿科临床前测试程序(PPTP)细胞系中表现出细胞毒活性, 中值相对IC <sub>50</sub> 为10.9mM(范围为2.7mM-24.5mM)。				
体内研究	在BALB/c nu/nu小鼠中, Pilaralisib(100mg/kg, p.o.)对固体胶质瘤异种移植诱导肿瘤生长抑制。Pilaralisib耐受良好, 在处理组仅具有0.7%的毒性率, 类似于观察到的对照组动物。在无胸腺雌性小鼠中, Pilaralisib(100mg/kg, p.o.)显著延缓肿瘤生长, 而没有显著的药物相关毒性。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 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	激酶反应使用荧光素酶-荧光素耦合的化学发光分析法进行, 随后对PI3K同工酶的激酶活性以ATP消耗的百分比测量, ATP浓度大约等于每个相应酶的K <sub>m</sub> 。激酶反应通过在20 $\mu$ l体积中结合测试化合物, ATP和激酶起始, PI3K $\alpha$ 、PI3K $\beta$ 、PI3K $\gamma$ 和PI3K $\delta$ 最终酶浓度分别为0.5、8、20和2nM。值得注意的是, 包含不同浓度测试化合物的0.5 $\mu$ l二甲亚砜(DMSO)与10 $\mu$ l酶溶液(2倍浓度)混合。激酶反应通过加入10 $\mu$ l磷脂酰肌醇和ATP溶液(2倍浓度)起始。VPS34、ATP和磷脂酰肌醇的试验浓度分别为40nM、1 $\mu$ M和5 $\mu$ M。

细胞实验	
细胞系	BT474细胞
浓度	6 $\mu$ M
处理时间	5天
方法	细胞增殖使用MTT或预混合的WST-1试剂测定。对于MTT/WST-1试验, 10000细胞/孔接种到96孔板。接

	种24小时后，细胞用DMSO或者pilaralisib处理。处理5天后，进行MTT/WST-1试验。
--	--

动物实验	
动物模型	负荷胶质瘤异种移植物的BALB/c nu/nu小鼠
配制	10mM HCl的无菌水溶液
剂量	100mg/kg
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

- 1.Foster P, et al. Mol Cancer Ther. 2015, 14(4), 931-940.
- 2.Reynolds CP, et al. Pediatr Blood Cancer. 2013, 60(5), 791-798.
- 3.Chakrabarty A, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 2012, 109(8), 2718-2723.
- 4.Yu P, et al. Mol Cancer Ther. 2014, 13(5), 1078-1091.
- 5.Rexer BN, et al. Clin Cancer Res. 2013, 19(19), 5390-5401.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF2775-10mM	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2775-5mg	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	5mg
SF2775-25mg	Pilaralisib (PI3K抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°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°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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