

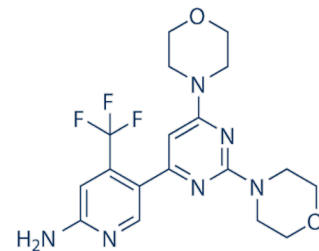
BKM120 (PI3K抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2726-10mM	BKM120 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2726-5mg	BKM120 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2726-25mg	BKM120 (PI3K抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-(2,6-dimorpholin-4-ylpyrimidin-4-yl)-4-(trifluoromethyl)pyridin-2-amine
简称	BKM120
别名	NVP-BKM120, Buparlisib, NVP-BKM120, NVP-BKM-120, BKM 120, BKM-120
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₂₁ F ₃ N ₆ O ₂
分子量	410.39
CAS号	944396-07-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 82mg/ml; Ethanol 2mg/ml
溶液配制	5mg加入1.22ml DMSO, 或每4.10mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2726-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	BKM120 (NVP-BKM120, Buparlisib)是一种选择性PI3K抑制剂, 在无细胞试验中作用于p110α/β/δ/γ的IC50分别为52nM/166nM/116nM/262nM。对VPS34, mTOR, DNAPK的作用效果下降, 而对PI4Kβ几乎没有活性。Phase 2。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	p110α	p110δ	p110β	p110γ	Vps34
IC50	52nM	116nM	166nM	262nM	2.4μM
体外研究	BKM120作用于解除PI3K调节的细胞系, 包括A2780、U87MG、MCF7和DU145时, 具有抗增殖活性, GI50为0.1-0.7nM。BKM120诱导多发性骨髓瘤细胞(ARP1、ARK、mM.1S、mM1.R和U266)凋亡, 导致G1期细胞增多, S期细胞减少。BKM120诱导CD138+原代MM细胞凋亡, 且作用于CD138-基质细胞时毒性较低。BKM120可引起BimS的上调和XIAP的下调。BKM120作用于人类胃癌细胞系, 降低mTOR下游信号, 具有抗增殖活性。BKM120作用于KRAS突变的胃癌细胞系, 可以增强p-ERK或 p-STAT3。BKM120和STAT3阻断剂联用, 作用于含突变KRAS的细胞, 诱导凋亡, 具有协同效应, 但是作用于KRAS野生型细胞没有这种效果。BKM120主要通过Aurora B激酶调节有丝分裂崩坏。				
体内研究	BKM120按30、60或100mg/kg剂量作用于A2780移植瘤, 完全抑制pAKTser473。BKM120按30和60mg/kg剂量作用于U87MG神经胶质瘤模型, 显示抗癌活性。BKM120每天按5μM/kg剂量处理具有持久生命力的ARP1 SCID鼠模型, 导致肿瘤体积和K链水平明显降低。				
临床实验	N/A				
特征	BKM120是可用于口服的生物有效的PI3K抑制剂。				

➤ 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	BKM120溶于DMSO中, 按每孔1.25μl直接加到黑色384孔板上。开始反应, 25μl 10nM PI3K和5μg/ml 1-α-磷酸肌醇(PI)加到实验buffer(10mM Tris pH为7.5, 5mM MgCl ₂ , 20mM NaCl, 1mM DTT及0.05% CHAPS), 然后加到每孔中, 随后在实验buffer中加入25μl 2μM ATP。反应进行直到50% ATP被消耗, 然后加入25μl KinaseGlo溶液终止反应。终止的反应温育5分钟, 然后通过荧光测定残留的ATP。

细胞实验

细胞系	A2780细胞
浓度	0-6.6μM
处理时间	3天
方法	A2780细胞培养在含10% FBS, L-谷氨酸, 丙酮酸钠和抗生素的DMEM培养基上。细胞按每孔10 ³ 个细胞的密度接种在相同培养基上, 温育3到5小时。稀释溶于20mM DMSO中的BKM120。2μl稀释的BKM120溶液加到细胞培养基上, (浓度为0-6.6μM)。等体积(100μl)溶液加到96孔板中, 在37°C下温育3天。使用Trilux读取荧光值而测定抑制细胞增殖的效果。

动物实验	
动物模型	携带U87MG和A2780移植瘤的雌性裸鼠
配制	15% Captisol
剂量	~60mg/kg
给药方式	每天口服处理

➤ **参考文献:**

1. Burger MT, et al. ACS Med Chem Lett, 2011, 2 (10), 774-779.
2. Park E, et al. Int J Oncol, 2012, 40(4), 1259-1266.
3. Koul D, et al. Clin Cancer Res, 2012, 18(1), 184-195.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF2726-10mM	BKM120 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2726-5mg	BKM120 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2726-25mg	BKM120 (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:

- 本产品对人体有毒, 操作时请特别小心, 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面积的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