



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

产品名称: **BAY1082439**

CAS 号: **1375469-38-7**

产品货号: **S87687**

生物活性:

生物活性:						
Description		BAY1082439 是一种具有口服活性的, 选择性 PI3K $\alpha/\beta/\delta$ 抑制剂。BAY1082439 也能抑制 PIK3CA 的突变形式, BAY1082439 对抑制 Pten 丢失的前列腺癌的生长有很强的作用。				
IC50 & Target[1]		PI3K α	PI3K β	PI3K δ		
In Vitro		BAY1082439 是一种高度选择性的 PI3K α/α -平衡抑制剂。BAY1082439 在 PI3K α (4.9 nM) 与 PI3K α (15.0 nM) 的生化测定中的 IC50 比率为 1:3, 并且对 mTOR 激酶的选择性 >1000 倍 [1]。				
		BAY1082439 (0.1-1 μ M; 72 小时) 比 PI3K α 和/或 PI3K β 选择性抑制剂更有效地阻断 PTEN 缺失的前列腺癌细胞[2]。				
		Cell Viability Assay[2]				
		Cell Line:	PC3 and LNCaP cells (PTEN-null human prostate cancer cell lines)			
		Concentration:	0.1, 0.33, 1, 3.3, 10 μ M			
		Incubation Time:	72 hours			
		Result:	Effectively inhibited cell growth by blocking the G1/S cell cycle transition and by inducing apoptosis.			
In Vivo		BAY1082439 (75 mg/kg; 口服; 每日一次, 持续 4 周) 可有效预防 Pten-n μ L1 前列腺癌进展[2]。				
		Animal Model:	Pten conditional knockout mouse model (Pb-Cre+;PtenL/L, CP model)[2]			
		Dosage:	75 mg/kg			
		Administration:	P.o.; daily for 4 weeks			
		Result:	Significantly decreased tumor size and P-AKT staining, nearly normal luminal architecture, and a significant reduction of Ki67-positive cells. Significantly inhibit the human prostate cancer growth.			
Solvent&Solubility		细胞实验:				
		0.1 M HCl 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (33.71 mM; 超声助溶 (<60° C))				
		DMSO 中的溶解度 : 5 mg/mL (10.11 mM; ultrasonic and adjust pH to 5 with HCl; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
		Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
			1 mM	2.0221 mL	10.1104 mL	20.2208 mL
			5 mM	0.4044 mL	2.0221 mL	4.0442 mL
			10 mM	0.2022 mL	1.0110 mL	2.0221 mL
		*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。				
		储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
		动物实验:				
以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶。						



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

	方案 一 请依序添加每种溶剂: 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 25 mg/mL (50.55 mM); 悬浊液; 超声助溶
参考文献	[1]. Ningshu Liu, et al. Abstract 2799: BAY 1082439, a highly selective and balanced PI3K α / β inhibitor demonstrated potent activity in tumors with activated PI3K α and loss-of-function of PTEN. Abstract nr 2799. doi:1538-7445.AM2012-2799. [2]. Yongkang Zou, et al. Co-Targeting the Cell Intrinsic and Microenvironment Pathways of Prostate Cancer by PI3K $\alpha / \beta / \delta$ inhibitor BAY1082439. Mol Cancer Ther. 2018 Oct;17(10):2091-2099.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C , 6 months; -20°C , 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO/0.1M HCl	1 mM	2.0221 mL	10.1104 mL	20.2208 mL	50.5520 mL
	5 mM	0.4044 mL	2.0221 mL	4.0442 mL	10.1104 mL
	10 mM	0.2022 mL	1.0110 mL	2.0221 mL	5.0552 mL
0.1 M HCl	15 mM	0.1348 mL	0.6740 mL	1.3481 mL	3.3701 mL
	20 mM	0.1011 mL	0.5055 mL	1.0110 mL	2.5276 mL
	25 mM	0.0809 mL	0.4044 mL	0.8088 mL	2.0221 mL
	30 mM	0.0674 mL	0.3370 mL	0.6740 mL	1.6851 mL