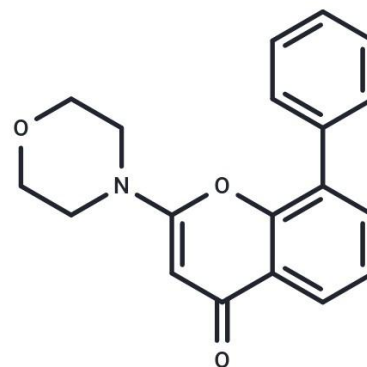


LY294002(PI3K 抑制剂)

货号: RPM0021

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	LY294002(PI3K 抑制剂)
别称/Synonyms:	LY 294002, NSC 697286, SF 1101
CAS 号/CAS NO.:	154447-36-6
化学式/Formula:	C ₁₉ H ₁₇ NO ₃
分子量/M.Wt:	307.34
外观/Appearance:	固体
保存条件/Storage:	Powder: -20°C, 3 年 Insolvent: -80°C, 1 年



◆ 溶解信息

溶解度/Solubility:	Ethanol: 10 mg/mL (32.5 mM)
	10% DMSO+40% PEG300+5% Tween 80+45% Saline: 3.4 mg/mL (11.06 mM), 现配现用.
	H ₂ O: < 1 mg/mL (不溶或微溶)
	DMSO: 61.46 mg/mL (200 mM), 建议超声处理.

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2537 mL	16.2686 mL	32.5373 mL
5 mM	0.6507 mL	3.2537 mL	6.5075 mL
10 mM	0.3254 mL	1.6269 mL	3.2537 mL
50 mM	0.0651 mL	0.3254 mL	0.6507 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	LY294002(PI3K 抑制剂)是一种 PI3K 的广谱抑制剂,可抑制 PI3K α 、PI3K δ 和 PI3K β (IC ₅₀ 分别为 0.5/0.57/0.97 μ M)。它也是 CK2 抑制剂 (IC ₅₀ 为 98 nM)和 DNA-PK 抑制剂 (IC ₅₀ 为 1.4 μ M),LY294002 还可以激活凋亡和自噬。
靶点活性/Targets (EC ₅₀)	p110 α :0.5 μ M (cell free),DNA-PK:1.4 μ M (cell free), p110 δ :0.57 μ M (cell free), p110 β :0.97 μ M (cell free).
体外活性/In vitro	人鼻咽癌细胞 CNE-2Z 用 LY294002 (10-75 μ mol/L) 处理 24-48 h, 使

	用 Flow Cytometry 方法检测细胞凋亡情况。结果显示 LY294002 剂量依赖性诱导 CNE-2Z 细胞凋亡。 ^[1]
体内活性/In vivo	将 LY294002 (25 mg/kg, 每周两次) 和 cisplatin (5 mg/kg, 每周一次) 腹腔注射给携带人胰腺癌肿瘤 AsPC-1 的 BALB/C nu/nu 小鼠, 持续三周。结果显示对照组小鼠的肿瘤体积增加, 而 cisplatin 或 LY294002 治疗组的肿瘤体积分别减少为 77% 和 70%。联合治疗组更有效, 肿瘤体积的生长下降到对照组体积的 44%。 ^[2]
激酶实验/Kinase Assay	LY294002 的 PI3K 抑制在放射测定法中使用具有 1 μ MATP 的纯化的重组酶 (IA 类和 IB 类) 测定。激酶反应在室温 (24 $^{\circ}$ C) 下进行 1 小时, 并通过加入 PBS 终止。随后使用 S 形剂量 - 响应曲线拟合 (可变斜率) 确定 IC ₅₀ 值。通过激酶选择性筛选确定 CK2 和 GSK3 β (糖原合成酶激酶 3 β) 抑制。在 10 μ M ATP 中对抗 Upstate 激酶组测试抑制剂 (10 μ M; PI828 和 LY294002) ^[3] 。
细胞实验/Cell Research	将人鼻咽癌细胞系 CNE-2Z 以 5000 个细胞/孔接种到 96 孔板中。24 小时, 除去培养基并在溶解于 DMSO 或 DMSO 中的 LY294002 (0 μ M, 10 μ M, 25 μ M, 50 μ M 和 75 μ M) 存在下更换另外 24 小时和 48 小时。DMSO 浓度维持在 0.5%。向每个孔中加入 MTT 染料 (5mg / mL)。通过加入 DMSO 终止反应, 并在多孔板读数器上在 490nm 处测量光密度。计算每个实验的平均值。结果表示为对照的百分比, 其被认为是 100% ^[1] 。
动物实验/Animal Research	通过腹腔注射戊巴比妥麻醉大鼠 ^[4] 体重 220-240g 的雄性 Sprague-Dawley 大鼠钠 (50mg / kg)。将动物分成 3 组: NMDA + 载体 (DMSO) (n = 46), NMDA + LY294002 (50nmol) (n = 25) 和 NMDA + 渥曼青霉素 (50nmol) (n = 23)。注射到一只眼睛的玻璃体腔内, 相同体积的 DMSO 是注射液。进入对侧眼的玻璃体腔。在注射后第 2 天和第 7 天评估视网膜中神经元和血管的损伤。

◆ 参考文献

- [1] Jiang H, et al. Phosphatidylinositol 3-kinase inhibitor(LY294002) induces apoptosis of human nasopharyngeal carcinoma in vitro and in vivo. J Exp Clin Cancer Res. 2010 Apr 22;29(1):34.
- [2] Fujiwara M, et al. Modulating effect of the PI3-kinase inhibitor LY294002 on cisplatin in human pancreatic cancer cells. J Exp Clin Cancer Res. 2008 Nov 25;27(1):76.
- [3] Gharbi SI, et al. Exploring the specificity of the PI3K family inhibitor LY294002. Biochem J. 2007 May 15;404(1):15-21.
- [4] Ueda K, et al. Differential effects of LY294002 and wortmannin on neurons and vascular endothelial cells in the rat retina. Pharmacol Rep. 2013;65(4):854-62.

◆ 注意事项

1. 请在收到本产品后立即按照说明书中推荐的条件保存, 使用前进行离心, 使粉末充分沉降于管底。
2. 请根据实验目的及本产品的溶解性, 选择相应的溶剂配制成高浓度母液后使用, 最佳工作浓度请参考相关文献通过实验摸索优化, 本说明书中的数据来源于公开文献, 仅供参考。
3. 本产品仅供科研使用, 不可用于诊断或治疗领域。
4. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。