

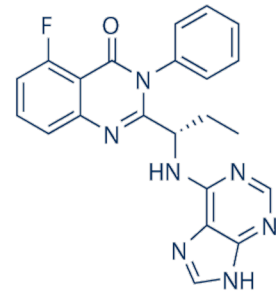
CAL-101 (PI3K抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2694-10mM	CAL-101 (PI3K抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2694-5mg	CAL-101 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2694-25mg	CAL-101 (PI3K抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-fluoro-3-phenyl-2-[(1S)-1-(7H-purin-6-ylamino)propyl]quinazolin-4-one
简称	CAL-101
别名	Idelalisib, GS-1101, CAL 101, CAL101, Zydelig
中文名	N/A
化学式	C ₂₂ H ₁₈ FN ₇ O
分子量	415.42
CAS号	870281-82-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 83mg/ml warming; Ethanol 23mg/ml
溶液配制	5mg加入1.20ml DMSO, 或每4.15mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2694-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	CAL-101 (Idelalisib, GS-1101)是选择性p110δ抑制剂, 在无细胞试验中IC ₅₀ 为2.5nM; 对p110δ表现出的选择性是对p110α/β/γ的40到300倍, 对p110δ的选择性是对C2β, hVPS34, DNA-PK和mTOR的400到4000倍。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	p110δ	p110γ	p110β	p110α	hVps34
IC ₅₀	2.5nM	89nM	565nM	820nM	978nM
体外研究	CAL-101对p110α、p110β和p110γ作用效果不大。CAL-101作用于原代嗜碱细胞特定阻断FccR1 p110δ调节的CD63表达, EC ₅₀ 为8nM。与急性髓性白血病(AML)和骨髓增生性肿瘤(MPN)细胞相比, CAL-101作用于B-cell急性淋巴细胞白血病(B-ALL)和慢性淋巴细胞白血病(CLL)细胞时显示更强的活性。CAL-101作用于SU-DHL-5、KARPAS-422和CCRF-SB细胞, 降低pAktS473、pAktT308和下游靶点S6, EC ₅₀ 为0.1到1.0μM。CAL-101作用于CLL细胞, 诱导选择性细胞毒性, 不是通过突变状态或间期细胞遗传学, 主要通过caspase依赖机制。与正常B细胞相比, CAL-101作用于CLL细胞优先产生细胞毒性和LY294002相比, 作用于其他造血细胞不会产生毒性。CAL-101作用于T细胞和天然杀伤细胞 缺乏直接的细胞毒性潜能。CAL-101抑制炎症细胞因子的产生, 比如IL-6、IL-10、TNF-α和IFN-γ, 且激活诱导的细胞因子, 如CD40L。CAL-101也抗CD40L调节的CLL细胞存活。CAL-101作用于L1236和L591细胞, 诱导细胞在G1期积累, 在S期下降, 说明 CAL-101可以作为治疗霍杰金淋巴瘤(HL)的一种新策略。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	Calistoga暗示CAL-101治疗血液恶性肿瘤可能有更广泛的应用价值。				

➤ 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	用全CLL和正常B细胞溶解物进行PI3K实验。进行PI3K ELISA实验。全细胞抽提物加到PI(4,5)P2底物和反应buffer(包含 ATP)的混合物中, 在室温下温育。加入PI(3,4,5)P3探测器和EDTA混合, 反应终止, 在室温下温育1小时。混合物转移到PI3K ELISA板上, 再温育1小时。冲洗反应板, 然后和第二探测器再温育30分钟。再次冲洗反应板, 加入3,3',5,5'-四甲基联苯胺溶液, 反应5分钟, 加入H ₂ SO ₄ 终止反应。在450纳米处读数。

细胞实验	
细胞系	CLL B细胞或健康志愿者的T细胞或NK细胞
浓度	0.01-100 μ M
处理时间	48小时
方法	进行MTT实验测定细胞毒性。1 \times 10 ⁵ 个细胞和CAL-101一起温育。加入MTT试剂，再次温育20小时，然后用溶于PBS的硫酸鱼精蛋白冲洗。加入DMSO，用分光光度计在540纳米处测定吸光度。使用膜联蛋白/PI液式细胞计检查在不同时间点测定细胞存活力，分析数据。每个样本至少计数10 ⁴ 个细胞。以全部阳性细胞与未处理细胞之比百分数的形式来表示实验结果。加入100 μ M Z-VAD检测caspase-依赖的细胞凋亡。加入1 μ g/ml CD40L，800U/ml IL-4，50ng/ml BAFF，20ng/ml TNF- α 测定存活信号，或者共培养在纤连蛋白或HS-5细胞系基质包被的板上。基质共培养在75cm ² 培养瓶(80%-100%融合率)培养24小时，然后加入CLL细胞。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

- 1.Lannutti BJ, et al. Blood, 2011, 117(2), 591-594.
- 2.Herman SE, et al. Blood, 2010, 116(12), 2078-2088.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF2694-10mM	CAL-101 (PI3K抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SF2694-5mg	CAL-101 (PI3K抑制剂)	5mg
SF2694-25mg	CAL-101 (PI3K抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当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