

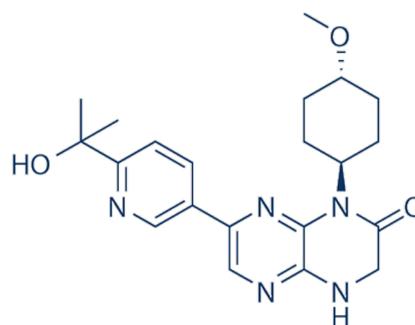
CC-223 (mTOR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2798-10mM	CC-223 (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2798-5mg	CC-223 (mTOR抑制剂)	5mg
SF2798-25mg	CC-223 (mTOR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-[6-(2-hydroxypropan-2-yl)pyridin-3-yl]-5-(4-methoxycyclohexyl)-7,8-dihydropyrazino[2,3-b]pyrazin-6-one
简称	CC-223
别名	CC0482223, UNII-I8RA3543SY, I8RA3543SY, SCHEMBL138069
中文名	N/A
化学式	C ₂₁ H ₂₇ N ₅ O ₃
分子量	397.47
CAS号	1228013-30-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 79mg/ml; Ethanol 79mg/ml
溶液配制	5mg加入1.26ml DMSO, 或每3.97mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2798-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	CC-223是一种高效选择性并具有口服活性的mTOR抑制剂, 其IC50为16nM。Phase 1/2。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	mTOR	cFMS	FLT4	DNA-PK	PI3K-α
IC50	16nM	28nM	651nM	840nM	4.0μM
体外研究	在许多的细胞系中, CC-223都抑制了mTORC1 (S6RP和4EBP1)和mTORC2 [AKT(S473)]标记物, 其IC50为pS6RP(27-184nM), p4EBP1(120-1050nM), pAKT(S473)(11--150)。CC-223还抑制了许多癌细胞系的生长并诱导了它们的凋亡。				
体内研究	在移植有PC-3肿瘤的小鼠中, CC-223(25mg/kg, p.o.)抑制了mTORC1和mTORC2的活性。除此之外, CC-223 (25mg/kg, p.o.)还导致了許多肿瘤模型, 包括前列腺癌、神经胶质瘤、乳腺癌、肺癌以及结肠癌模型中的肿瘤生长抑制, 抑制效果47%-95%不等。				
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	试剂准备如下: 10mM Tris pH 7.4, 100mM NaCl, 0.1% Tween-20, 1mM DTT。重组的mTOR溶解在前面的缓冲液中终浓度为0.200ug/ml。ATP/底物溶液: 0.075mM ATP, 12.5mM MnCl ₂ , 50mM Hepes, pH 7.4, 50mM β-GOP, 250nM Microcystin LR, 0.25mM EDTA, 5mM DTT和3.5μg/ml GST-p70S6。稀释曲线: 10个1:3稀释的化合物在纯DMSO中制备。检测试剂混合液: 50mM HEPES, pH 7.4 0.01% Triton X-100, 0.01% BSA 0.1mM EDTA, 12.7μg/ml Cy5-anti-GST antibody, 9ng/ml anti-phospho p70S6 antibody (Thr389), 627ng/ml anti-mouse IgG labeled with Lance Eu。将0.5μl的按照稀释曲线配置的化合物放入到20μl缓冲液中。化合物的终浓度范围是30-0.0015μM。随后加入5μl ATP/底物溶液启动该反应。反应进行60min。然后加入10μl的检测试剂混合物, 2小时后检测反应值。

细胞实验	
细胞系	PC-3, CAL-51, A549, T47D, NCI-H460, HepG2, AU565, Hep3B, HCC, U87MG, HCT116,

	MDA-MB-231和NCI-H23细胞
浓度	~10 μ M
处理时间	72h
方法	使用分液器将化合物放入384孔板中，将细胞稀释并放入到装有化合物的孔中。细胞生长72小时，并用Cell Titer-Glo检测其活性。利用DMSO处理得细胞作为对照。结果GI50或者IC50表示。

动物实验	
动物模型	移植有PC-3、U-87MG、HCT 116、MDA-MB-231或者A549的小鼠肿瘤模型
配制	aqueous 0.5% carboxymethyl cellulose和0.25% Tween-80的悬浮液
剂量	25mg/kg
给药方式	p.o.

➤ 参考文献:

1.Mortensen DS, et al. Mol Cancer Ther. 2015, 14(6), 1295-1305.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF2798-10mM	CC-223 (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2798-5mg	CC-223 (mTOR抑制剂)	5mg
SF2798-25mg	CC-223 (mTOR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