

ZSTK474

产品信息

产品名称	产品编号	规格
ZSTK474	53885ES10	10 mg
	53885ES50	50 mg

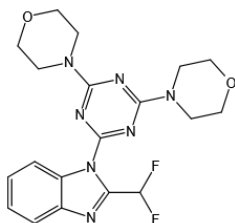
产品描述

ZSTK474 (ZSTK-474)是可口服的、ATP 竞争性 I 类 PI3K 选择性抑制剂，是 s-三嗪衍生物，可以与 PI3K 的 ATP 结合袋结合进而抑制 PI3K 活性，作用于 PI3K $\alpha/\beta/\delta/\gamma$ 的 IC₅₀ 为 16 nM、44 nM、4.6 nM 和 49 nM，具有抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	ZSTK474, ZSTK-474
靶点 (Target)	PI3K
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--PI3K
CAS 号 (CAS NO.)	475110-96-4
分子式 (Formula)	C ₁₉ H ₂₁ F ₂ N ₇ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	417.41
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃，有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存，避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

在 OVCAR3 细胞中, ZSTK474 (10 μ M) 诱导细胞凋亡和细胞周期 G1 期阻滞; 在 MEF 细胞中, ZSTK474 (1 μ M) 阻断血小板源生长因子诱导的胞膜边缘波动和 PIP3 产生。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 B16F10 移植瘤小鼠模型中, 口服 ZSTK474 (100-400 mg/kg) 抑制肿瘤生长。^[1] 在脑缺血/再灌注小鼠模型中, 给药 ZSTK474 (50-300 mg/kg) 减轻了神经功能缺损并减少了梗死体积。^[3]

参考文献

- [1] Yaguchi S, et al. Antitumor activity of ZSTK474, a new phosphatidylinositol 3-kinase inhibitor. J Natl Cancer Inst. 2006 Apr 19;98(8):545-56.
- [2] Kong D, et al. ZSTK474 is an ATP-competitive inhibitor of class I phosphatidylinositol 3 kinase isoforms. Cancer Sci. 2007 Oct;98(10):1638-42.
- [3] Wang P, et al. Class I PI3K inhibitor ZSTK474 mediates a shift in microglial/macrophage phenotype and inhibits inflammatory response in mice with cerebral ischemia/reperfusion injury. J Neuroinflammation. 2016 Aug 22;13(1):192.