

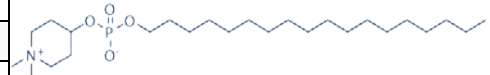
Perifosine (Akt抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|------------|
| SC0227-10mM | Perifosine (Akt抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC0227-5mg | Perifosine (Akt抑制剂) | 5mg |
| SC0227-25mg | Perifosine (Akt抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|--|
| 化学名 | (1,1-dimethylpiperidin-1-ium-4-yl)octadecyl phosphate |
| 简称 | Perifosine |
| 别名 | D 21266, D-21266, D21266, NSC 639966, NSC 639966, NSC639966, KRX 0401, KRX-0401, KRX0401 |
| 中文名 | 呱立福辛 |
| 化学式 | C ₂₅ H ₅₂ NO ₄ P |
| 分子量 | 461.66 |
| CAS号 | 157716-52-4 |
| 纯度 | 98.0% |
| 溶剂/溶解度 | Water 125mg/ml; DMSO <1.2mg/ml; Ethanol 15mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入1.08ml 超纯水, 或每4.62mg加入1ml超纯水, 配制成10mM溶液。SC0227-10mM用超纯水配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------|--|---|---|---|---|
| 产品描述 | Perifosine(KRX-0401)是一种新型的Akt抑制剂, 在MM.1S细胞中IC50为4.7μM, 靶向作用于Akt的pleckstrin同源结构域。Phase 3。 | | | | |
| 信号通路 | PI3K/Akt/mTOR; Cytoskeletal Signaling | | | | |
| 靶点 | Akt | — | — | — | — |
| IC50 | 4.7μM | — | — | — | — |
| 体外研究 | Perifosine抑制永生角质形成细胞(HaCaT细胞)和头颈部鳞状癌细胞增值, IC50为0.6-8.9μM。Perifosine极大减少Akt的磷酸化水平和细胞外信号调节激酶(ERK)1/2, 诱导细胞周期停滞在G1和G2, 并引起的小鼠的神经胶质祖细胞的剂量依赖性生长抑制。Perifosine(10μM)完全抑制MM.1S细胞中Akt的磷酸化。最近的一项研究表明Perifosine通过阻断Akt的磷酸化诱导人类肝癌细胞中细胞周期停滞和细胞凋亡。 | | | | |
| 体内研究 | Perifosine和temozolomide联用在体内可减少肿瘤的增殖(PDGF驱动胶质瘤发生)。结果表明, Perifosine是一种有效抑制神经胶质瘤的药物并且可能是治疗神经胶质瘤的候选药物, 在神经胶质瘤中的Akt和Ras-ERK1/2途径常常被激活。与PBS处理的对照动物相比, 日服和周服Perifosine显著减少人MM肿瘤的生长并提高成活率。Perifosine诱导血小板和白细胞增多, 增加髓小鼠骨髓和脾脏, 而它会导致移植骨髓瘤的凋亡。 | | | | |
| 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 | 在MM.1S细胞中添加或不添加Perifosine(5μM, 6小时), 然后用IL-6(20ng/ml, 10分钟)刺激。体外Akt激酶活性测定试验使用Akt激酶检测试剂盒。 |

| 细胞实验 | |
|------|----------|
| 细胞系 | 人脑胶质瘤细胞系 |

| | |
|------|---|
| 浓度 | 0、15、30和45 μ M |
| 处理时间 | 48小时 |
| 方法 | 细胞在含10% FCS的培养基中培养48小时，添加不同浓度的Perifosine。细胞活力通过3-(4,5-二甲基吡啶-2-基)-2,5-二苯基溴化镁(MTT)法确定。(细胞增殖试剂盒I, 罗氏)。在590nm处的吸光度是用96孔读板仪记录。 |

| 动物实验 | |
|------|----------------------------------|
| 动物模型 | MM.1S MM细胞在BNX裸鼠(5~6周龄)的右腰部皮下接种。 |
| 配制 | 0.9% NaCl溶液 |
| 剂量 | 250mg/kg/wk或者36mg/kg/d |
| 给药方式 | 口服 |

参考文献：

1. Vyomesh Patel, et al. Cancer Res. 2002; 62(5):1401-1409.
2. Momota H, et al. Cancer Res. 2005; 65(16):7429-7435.
3. Hideshima T, et al. Blood. 2006; 107(10):4053-4062.
4. Catley L, et al. Exp Hematol. 2007; 32(7):1038-1046.
5. Fei HR, et al. Cytotechnology. 2010; 62(5):449-460.

包装清单：

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|---------------------|
| SC0227-10mM | Perifosine (Akt抑制剂) | 10mM \times 0.2ml |
| SC0227-5mg | Perifosine (Akt抑制剂) | 5mg |
| SC0227-25mg | Perifosine (Akt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降于管底后再开盖使用。
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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其它相关文献，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等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09