

Miltefosine ; 米替福新

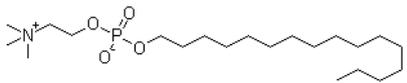
产品编号：MB1816

质量标准：>98%,BR

包装规格：100MG;500MG

产品形式：白色或类白色粉末

基本信息

分子式	C21H46NO4P	结构式	
分子量	407.57		
CAS No.	58066-85-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : Insoluble H ₂ O: 10 mg/mL Ethanol : 81 mg/mL (198.73 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：米替福新 Miltefosine 是一种 **Akt** 抑制剂，大大减少 **HIV-1** 从病毒感染的巨噬细胞产生。

别名： HePC; Hexadecyl phosphocholine; Ethanaminium,

2-[[hexadecyloxy)hydroxyphosphinyl]oxy]-N,N,N-trimethyl-, inner salt

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

熔点：.....232.2-233.9 °C (dec.)

溶解性：.....DMSO : Insoluble; H₂O: 10 mg/mL; Ethanol : 81 mg/mL (198.73 mM)

含量：.....>98%

储存条件： -20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Miltefosine 作用于癌细胞系 A431 和 HeLa 抑制 PI3K/Akt 活性 ,ED50 分别为 17.2 μM 和 8.1 μM ,是第一个用于治疗内脏利什曼病的口服药物，有效对抗前鞭毛体和无鞭毛体。		
靶点	Akt	PI3K	PKC ~7 μM
体外研究	Miltefosine 是一种烷基磷酸胆碱药，对各种寄生虫虫种，癌症细胞，以及一些致病菌与真菌均具有活性。Miltefosine 抑制无细胞提取物中来自 NIH3T3 细胞的 PKC ，IC50 约为 7 μM。Miltefosine 以 HIV 感染的巨噬细胞为靶点 其在体内扮演长期的 HIV-1 储存库。Miltefosine 通过抑制 PI3K/Akt 通路发挥作用，从而移除循环中感染的巨噬细胞，而不影响健康细胞。Miltefosine 抑制癌细胞系中 PI3K/Akt 存活通路。Miltefosine 通过干扰胰岛素信号通路，并抑制胰岛素刺激的葡萄糖摄取，引起体外骨骼肌胰岛素抵抗。Miltefosine 剂量依赖性抑制胰岛素刺激的 Akt 磷酸化，40 μM 下抑制 75%，60 μM 下抑制 98%。		
体内研究	Miltefosine 抑制抗- IgE 诱导的组胺从肥大细胞的释放。Miltefosine 能够减少某些皮肤组织细胞中的细胞因子 IL-1β，IL-4，和 IL-6，并强烈阻碍胆固醇的酯化反应		

美仑相关产品推荐

MB5799	渥曼青霉素
MB1880	哌立福新(KRX-0401)
MB3649	曲西立滨
MB4498	AT13148
CL-10066	AT7867
MB3647	AZD5363

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。米替福新 mitefosine 是一种具有生物活性的烷基磷脂，是一种 PI3-K 和 Akt 抑制剂，也能够抑制抗免疫球蛋白诱导的组胺释放。大大减少 HIV-1 从病毒感染的巨噬细胞产生。抑制蛋白激酶 C 和磷脂酰胆碱合成。可能被用于研究其药代动力学、代谢、安全性、有效性和递送配方，作为一种潜在的治疗方法，用于治疗癌症，如皮肤淋巴瘤、皮肤转移性黑色素瘤、鳞状细胞癌和乳腺癌的皮肤转移。还可用于研究其作为抗利什曼病(抗原动物)药物的作用机制和价值。mitefosine 可能被用来研究它对细胞信号通路的影响，这些通路包括 p38 MAPK 通路的激活以及 Akt 信号通路的差异下调。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4536 mL	12.2678 mL	24.5357 mL
5 mM	0.4907 mL	2.4536 mL	4.9071 mL
10 mM	0.2454 mL	1.2268 mL	2.4536 mL
50 mM	0.0491 mL	0.2454 mL	0.4907 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	使用 ApoAlert 半胱天冬酶荧光测定试剂盒定量酶活性胱天蛋白酶-3 的水平。简而言之，用 50 μ M 米替福新, 50 μ M Perifosine 或 20nM NVP-BEZ235 以及相应的载体对照处理 1×10^6 BC-1 PEL 细胞。收获细胞并在 12 小时后裂解。将所有样品的等效微克细胞裂解物与荧光半胱天冬酶-3 底物 (DEVD-AFC) 一起温育。通过胱天蛋白酶-3 裂解 DEVD 释放 AFC，其荧光使用 FLUOstar OPTIMA 荧光计测量，激发和发射滤光器波长分别设定为 400 和 505nm。
细胞实验	将米替福新 (HePC) 制备成含有 10mM 米替福新在 20mM Tris-HCl, pH7.4 中的储备溶液，并储存 (-20°C)，然后在使用前稀释。 NIH3T3 细胞在补充有 10%FCS 的 DMEM 中在 95%空气和 5%CO ₂ 的潮湿气氛中生长。将细胞以 $0.5-0.8 \times 10^5$ 个细胞/孔接种在 35-mm 培养皿 (6 孔板) 上。确定生长 18-24 小时并确定代表性孔的细胞数 (时间 0)。通过向细胞或等体积的 Tris-HCl 添加新制备的给予浓度的米替福新溶液来开始实验以控制细胞。孵育 60 小时后，用电子计数器计数细胞。计算细胞增殖。
动物实验	将米替福新溶解在 PBS (小鼠) 中。 米替福新 (MFS) 制备为水溶液或 MFS-脂质纳米胶囊 (LNC) 分散体 (大鼠)。 老鼠 将 PEL 细胞在冰冷的磷酸盐缓冲盐水中洗涤，计数，并在 100 μ L 与 100 μ L 贫化生长因子的基质胶混合的 PBS 中稀释。将总共 1×10^5 至 7.5×10^5 个 BC-1 细胞皮下注射到 NOD.CB17-Prkdcscid/J 或 CB17-Prkdcscid/J 小鼠的右肋腹中。隔天监测小鼠的可触及肿瘤 (2mm ³) 的发展，此时开始药物或媒介物治疗，并且每周 5 天腹腔内 (哌立福辛) 或通过口服强饲法 (罗格列酮, NVP-BEZ235) 施用。使用 5 至 7 只小鼠的组来产生 PEL 肿瘤并用载体或药物混合物处理。

每个生物学实验重复多次。对于罗格列酮，使用 0.25% 甲基纤维素作为载体，并将 30mg / kg 或 60mg / kg 罗格列酮悬浮于甲基纤维素中。对于 Perifosine 和 Miltefosine，PBS 用作载体，50mg / kg Perifosine 或 Miltefosine 溶解在 PBS 中。对于 NVP-BEZ235，将化合物溶于 1 : 9 vol / vol 的 1-甲基-2-吡咯烷酮和聚乙二醇 300 的混合物中。给予 40mg / kg 剂量的 NVP-BEZ235 或等体积的载体。使用数字卡尺测量肿瘤直径，并计算肿瘤体积。切除肿瘤并在福尔马林中固定。使用线性模型拟合进行统计分析，其中最大可能性是将个体动物视为随机效应。

大鼠

将雄性 Sprague-Dawley 大鼠 (体重 270-290g) 分成五组 (n = 5)。治疗组中的大鼠通过胃管饲法以水溶液或 MFS-LNCs 分散体施用单次 10mg / kg 口服剂量的米替福新 (MFS)。该剂量相当于在校正大鼠后在临床前研究中给小鼠施用的 20mg / kg 米替福新剂量。给药后，在麻醉下，在含有 EDTA 的 Eppendorf 管中以 0.5,1,2,4,7,10,24,48,72 和 216 小时的时间间隔通过眼眶丛收集血液样品。然后将血液样品立即以 4000rpm 离心 10 分钟。将血浆样品冷冻并保持在 -80°C 待分析。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。