

## Perifosine ; 哌立福新(KRX-0401)

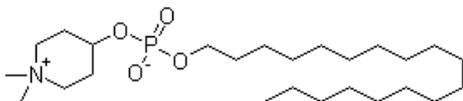
产品编号：MB1880

质量标准：≥98%

包装规格：20MG;200MG

产品形式：白色至米黄色粉末

### 基本信息

|               |   |             |  |
|---------------|---|-------------|--|
| 分子式           | C25H52NO4P  | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量           | 461.66  |             |  |
| CAS No.       | 157716-52-4   |             |  |
| 储存条件          | -20°C，避光防潮密闭干燥  |             |  |
| 溶解性<br>(25°C) | DMSO Insoluble<br>Water : 8 mg/mL (17.32 mM)<br>Ethanol 15 mg/mL (32.49 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：**哌立福新 Perifosine 是一种口服有效的 **Akt** 抑制剂。Perifosine 对绝大多数细胞具有抗增殖活性，IC<sub>50</sub> 为 0.6-8.9 μM。

**别名：**Perifosine (KRX-0401)；哌立福新；NSC 639966;D-21266; D21266;D 21266;

(1,1-Dimethylpiperidin-1-ium-4-yl) octadecyl phosphate;

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至米黄色粉末

溶解性：.....DMSO Insoluble；Water：8 mg/mL (17.32 mM)；Ethanol 15 mg/mL (32.49 mM)

含量：.....≥98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

|                      |   |                      |        |
|----------------------|---|----------------------|--------|
| <b>产品描述</b>          | Perifosine (KRX-0401)是一种新型的 <b>Akt</b> 抑制剂，在 MM.1S 细胞中 <b>IC50</b> 为 4.7 μM，靶向作用于 Akt 的 pleckstrin 同源结构域。   |                      |        |
| <b>靶点</b>            | <table border="1"> <tr> <td>Akt<br/>(MM.1S cells)</td> </tr> <tr> <td>4.7 μM</td> </tr> </table>  | Akt<br>(MM.1S cells) | 4.7 μM |
| Akt<br>(MM.1S cells) |   |                      |        |
| 4.7 μM               |   |                      |        |
| <b>体外研究</b>          | Perifosine 抑制永生化角质形成细胞 (HaCaT 细胞) 和头颈部鳞状癌细胞增值，IC <sub>50</sub> 为 0.6-8.9 μM。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 (10 μM) 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 |                      |        |
| <b>体内研究</b>          | 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，口服和周服 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。

#### 美仑相关产品推荐

|        |                        |
|--------|------------------------|
| MB3650 | A-674563               |
| MB4498 | AT13148                |
| MB3647 | AZD5363                |
| MB4497 | GSK-2141795,Uprosertib |
| MB5663 | Ipatasertib(GDC0068)   |
| MB3648 | MK-2206 2HCl           |
| MB3651 | PHT-427                |

**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。派立福新是一种能够抑制 Akt 的活性和抗凋亡 MAPK 通路的烷基磷脂。是一种口服有效的 Akt 抑制剂。Perifosine 对绝大多数细胞具有抗增殖活性。

#### 储液配置

|       | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|-------|-----------|------------|------------|
| 1 mM  | 2.1661 mL | 10.8305 mL | 21.6610 mL |
| 5 mM  | 0.4332 mL | 2.1661 mL  | 4.3322 mL  |
| 10 mM | 0.2166 mL | 1.0830 mL  | 2.1661 mL  |
| 50 mM | -         | -          | -          |

#### 经典实验操作（仅供参考）

|              |  |
|--------------|--|
| <b>激酶实验：</b> | <b>Akt 激酶活性：</b><br>在 MM.1S 细胞中添加或不添加 Perifosine ( 5 μM, 6 小时 )，然后用 IL-6 ( 20 ng/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。   |
| <b>细胞实验：</b> | <b>Cell lines:</b> 人脑胶质瘤细胞系<br><b>Concentrations:</b> 0, 15, 30 和 45 μM<br><b>Incubation Time:</b> 48 小时<br><b>Method:</b> 细胞在含 10%FCS 的培养基中培养 48 小时，添加不同浓度的 Periosine。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。 |
| <b>动物实验：</b> | <b>Animal Models:</b> MM.1S MM 细胞在 BNX 裸鼠 ( 5~6 周龄 ) 的右腰部皮下接种。<br><b>Formulation:</b> 0.9% NaCl 溶液<br><b>Dosages:</b> 250 mg/kg/wk 或者 36 mg/kg/d<br><b>Administration:</b> 口服  |

#### 【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。