

PFK-015 ; PFK15

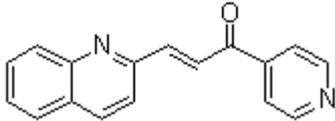
产品编号：MB3454

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C17H12N2O	结构式	
分子量	260.29		
CAS No.	4382-63-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO :19 mg/mL warmed (72.99 mM) Water : Insoluble Ethanol : 2 mg/mL warmed (7.68 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：PFK-015 是 PFKFB3 抑制剂，对重组 PFKFB3 的 IC50 为 110 nM，能抑制肿瘤细胞内 PFKFB3 活性，IC50 为 20 nM。

别名：1-(4-Pyridinyl)-3-(2-quinolinyl)-2-propen-1-one ; PFK15

物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

溶解性：.....DMSO :19 mg/mL warmed (72.99 mM) ;Water :Insoluble ;Ethanol :2 mg/mL warmed (7.68 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	PFK15 是一种强效的选择性的 6-phosphofructo-2-kinase (PFKFB3)抑制剂，其 IC50 为 207 nM。
靶点	PFKFB3 (Cell-free assay) 207 nM
体外研究	PFK15 能够在一系列癌细胞中产生有效的生长抑制。在 Jurkat T-细胞白血病细胞和 H522 肺腺癌细胞中，PFK15 也会减少 F26BP，葡萄糖摄取，和细胞内 ATP 水平。
体内研究	在体内，PFK15 有适当的药代动力学性质。PFK15 (25 毫克/千克，腹腔注射)抑制同源小鼠体内 LLC 肿瘤的生长，转移扩散和葡萄糖代谢。在三个人异种移植的无胸腺癌症小鼠模型中，PFK15 也会产生与认证的化疗药物相似的抗癌作用。

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。PFK15 是 PFKB3(6-磷酸果糖-2-激酶/果糖-2,6-二磷酸酯酶 3)的有效选择性拮抗剂，可迅速诱导癌细胞凋亡和转化细胞。PFK15 抑制异种移植瘤 LLC 的生长。本品适用于该领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		3.8419 mL	19.2093 mL	38.4187 mL
5 mM		0.7684 mL	3.8419 mL	7.6837 mL
10 mM		0.3842 mL	1.9209 mL	3.8419 mL
50 mM		0.0768 mL	0.3842 mL	0.7684 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	重组 PFKFB3 试验: 激酶反应通过在室温下将 13 纳克重组人 PFKFB3 蛋白反应混合物培育 1 小时进行,反应混合物包含 10 μmol/L ATP, 10 μmol/L F6P, 和二甲亚砜(DMSO)载体对照, 3PO, 或 PFK15. 激酶活性用 Adapta Universal 激酶分析测定, 根据制造商的说明书和荧光以及 FRET 信号在 Tecan Safire2 板阅读器上测定。使用 SigmaPlot 软件生成曲线图, IC50 值使用三参数 Hill 方程计算。
细胞实验：	Cell lines: 59 癌细胞系 Concentrations: ~30 μM Incubation Time: 48 小时 Method: 活性通过台盼蓝排除法确定。细胞在 20%台盼蓝中培育 5 分钟。台盼蓝排除的细胞使用标准血细胞计数以测定总的活细胞数。实验重复进行 3 次。
动物实验：	Animal Models: LLC 异种移植的 C57Bl/6 小鼠, CT26, U-87 MG, 或 BxPC-3 异种移植的 Balb/C 无胸腺小鼠。 Formulation: DMSO Dosages: 每 3 天 25 毫克/千克 Administration: 腹腔注射

【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。