

Ridaforolimus (Deforolimus, MK-8669)

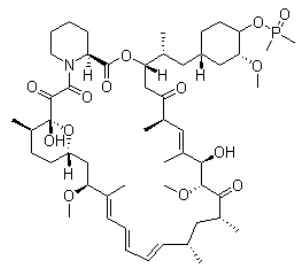
产品编号：MB3639

质量标准：>98%，选择性的 mTOR 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C53H84NO14P	结 构 式	
分子量	990.21		
CAS No.	572924-54-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 198 mg/mL (199.95 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
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：Deforolimus (AP23573; MK-8669) 是一种有效和选择性的 mTOR 抑制剂，在 HT-1080 细胞中抑制 S6 磷酸化的 IC₅₀ 值为 0.2 nM。

别名：AP23573;药雷帕霉素;MK 8669; 42-(二甲基亚磷酰)雷帕霉素;AP23573; MK-8669; Ridaforolimus; AP 23573; MK 8669; AP-23573; MK8669;42-(Dimethylphosphinate)rapamycin

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 198 mg/mL (199.95 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

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	Deforolimus (Ridaforolimus MK-8669)是选择性的 mTOR 抑制剂，IC ₅₀ 为 0.2 nM;但没分类为一种前体药物，抑制 mTOR 信号通路及与 FKBP12 结合与 Rapamycin 相似。
靶点	mTOR
IC₅₀	0.2 nM
体外研究	使用 Deforolimus 处理 HT-1080 细胞，抑制 S6 和 4E-BP1 磷酸化，这种作用存在剂量依赖性，IC ₅₀ 分别为 0.2 nM 和 5.6 nM，EC ₅₀ 分别为 0.2 nM 和 1.0 nM，且导致细胞尺寸降低，G1 期细胞增多，和抑制葡萄糖摄取，EC ₅₀ 为 0.1-1 nM。Deforolimus 作用于—组细胞系，具有显著抗增殖活性，EC ₅₀ 为 0.2-2.3 nM。Deforolimus 有效且选择性抑制 VEGF 产量，这种作用存在剂量依赖性，EC ₅₀ 为~0.1 nM。Deforolimus 作用于人 NSCLC 细胞系(除了 H157 细胞)，显著抑制细胞生长，IC ₃₀ 为 2.45-8.83 nM,而作用于 H157 细胞时，IC ₃₀ >20 nM。2.8-5.9 nM Deforolimus 处理 A549, H1703 和 H157 细胞(除了表达 mTORC1 耐药变异的 H1666)，

	使 p70S6KThr389 去磷酸化,且作用于 A549 和 H1703 细胞 提高 pAKTser473 和 pAKTThr308 磷酸化水平。Deforolimus 和 MEK 抑制剂 CI-1040 或 PD0325901 联用处理人肺癌细胞系, 具有协同作用, 这种作用存在剂量依赖性, 这种作用与细胞增殖受抑制而不是细胞死亡增多相关, 处理 24 小时后, 抑制 40%核糖体合成, 且使多核糖体/染色单体比例下降。
体内研究	Deforolimus 处理携带 PC-3 (前列腺), HCT-116 (结肠), MCF7 (胸腺), PANC-1 (胰腺)或 A549 (肺) 移植瘤的小鼠, 具有显著抗癌效果, 这种作用存在剂量依赖性, 且作用于 SK-LMS-1 移植瘤, 抑制 mTOR 信号。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5645	AZD8055
MB1596	BEZ235 (Dactolisib)
MB1197	Rapamycin(Sirolimus)

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。Ridaforolimus (Deforolimus, MK-8669)是一种选择性的 mTOR 抑制剂, 对 mTOR 信号通路的抑制作用及与 FKBP12 结合能力和 Rapamycin 接近。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.0099 mL	5.0494 mL	10.0989 mL
5 mM	0.2020 mL	1.0099 mL	2.0198 mL
10 mM	0.1010 mL	0.5049 mL	1.0099 mL
50 mM	0.0202 mL	0.1010 mL	0.2020 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	激酶实验: 用浓度不断提高的 Deforolimus (0-100 nM)处理 HT-1080 细胞 2 小时, 然后收集。在变性裂解 buffer 中抽细胞裂解液, 在 SDS-PAGE 上分析, 然后转移到 PVDF 膜上。阻断后,膜和一抗在室温下温育 1 小时, 随后和适当的 HRP 联合二抗再温育 1 小时。使用增强化学荧光法, 及 X-光片进行曝光自显影, 而测定免疫蛋白。通过抑制磷酸化的核糖体蛋白 S6(p-S6)和 4E-BP1(p-4E-BP1)水平而测定 IC50 值。
细胞实验 :	Cell lines: Colo205, H1755, H1395, H1666, A549, H157,和 H1703 Concentrations: 溶于乙醇,终浓度为 1 μM Incubation Time: 72-120 小时 Method: 细胞按 2 到 3×10 ⁴ /mL 接种, 2 小时后加入梯度稀释的 Deforolimus ,结果至少三组细胞倍增(72-120 小时)。使用 CellTiter 96 AQueous 非放射性增殖实验和 Sulforhodamine B 实验测定 Deforolimus 作用效果。对于 Deforolimus , 增长效应被描述为 IC30 , 因为 Rapamycin 和其衍生物不显著抑制细胞增殖。
动物实验 :	Animal Models: 皮下移植 PC-3, A549, HCT-116, MCF7, PANC-1 和 SK-LMS-1 肿瘤的雄性和雌性无胸腺 NCr-nu 小鼠。

	Formulation: 溶于乙醇,然后在 4% 乙醇, 5% Tween-80, 和 5% 丙二醇中稀释 Dosages: ~10 mg/kg 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。