

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	P10091
产品名称:	Perifosine

产品简介:

一种 Akt 抑制剂。	
靶点:	Autophagy
体外研究:	
MTT 法测定 Ntv-a/LacZ 细胞系生长的 IC50。当细胞在添加 10% FCS 的培养基中培养 48 小时时, 具有组成型活性 PDGF、Ras 或 Akt 信号转导的细胞的 IC50 相似, 约为 45 μ M。Perifosine, 一种口服生物可利用的烷基磷脂 (ALK), 对永生角质形成细胞 (HaCaT) 以及头颈部鳞状癌细胞的细胞周期动力学的影响。通过将 [³ H] 胸苷掺入细胞 DNA 来评估增殖。暴露于 Perifosine (0.1-30 μ M) 24 小时会导致所有测试细胞系中 [³ H] 胸苷摄取的剂量依赖性抑制。生长的 IC50 介于 0.6 和 8.9 μ M 之间, 达到 IC80 ~10 μ M。Perifosine 通过诱导 p21 ^{WAF1} 在 G1-S 和 G2-M 阻断头颈部鳞状癌细胞的细胞周期进程, 无论 p53 功能, 并且可以在临床上加以利用, 因为大多数人类恶性肿瘤都存在 p53 突变。Perifosine (20 μ M) 诱导 G ₁ -S 和 G ₂ -M 细胞周期停滞, 以及和 p21 ^{WAF1} 表达 > p53 野生型和 p53 ^{-/-} 克隆。	
体内研究:	
通过生物发光成像鉴定小鼠患有肿瘤, 并用 100 mg/kg Temozolomide 或 30 mg/kg Perifosine 或 100 mg/kg Temozolomide 和 30 mg/kg Perifosine 的组合 (Temozolomide + Perifosine) 处理 3 至 5 天。处死小鼠并通过 Ki-67 免疫染色对肿瘤进行组织学细胞增殖分析。用 Temozolomide (Ki-67 染色指数=5.5 $\pm$ 1.2%, n=4, P=0.0019) 或 Perifosine (Ki-67 染色指数=3.2 $\pm$ 1.1%, n=3, P=0.001) 与 Control 相比, 显示出对增殖的抑制作用。最重要的是, 用 Temozolomide+ Perifosine 处理的肿瘤具有最低的 Ki-67 染色指数 (1.7 $\pm$ 1.2%, n=3, P=0.0005)。Perifosine 的额外处理导致增殖率显著低于单独的替莫唑胺 (P=0.0087)。Perifosine 在注射后 10 分钟至 24 小时显著降低 p-Akt, 随后在注射后 1 小时至 24 小时适度降低 p-S6。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
Water: 溶于水 (8mg/ml)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
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
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month.			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: PBS			
Solubility: 50 mg/mL (108.30 mM); 澄清溶液; 超声助溶			
注: 工作液建议您现用现配, 在短期内尽快用完。			



<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

三、激酶实验

Akt 激酶活性：

在 MM.1S 细胞中添加或不添加 Perifosine (5 μ M, 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。

四、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。

四、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。

剂量：250 mg/kg/wk 或者 36 mg/kg/d

给药处理：口服

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存：-20℃

