

HB220119

Perifosine (KRX-0401; NSC 639966; D21266)

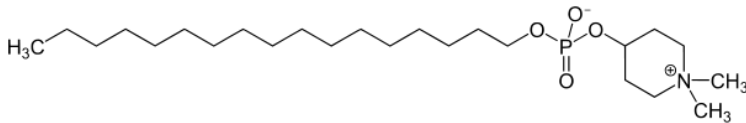
产品信息

产品名称	产品编号	规格
Perifosine (KRX-0401; NSC 639966; D21266)	52409ES08	5 mg
	52409ES25	25 mg

产品描述

Perifosine (KRX-0401) 是一种新型合成的烷基磷脂化合物, 靶向作用于细胞膜和阻断 Akt 激活的抗肿瘤药物, 结构与天然形成的磷脂相似。Perifosine 是具有口服生物活性的 Akt 抑制剂, 具有抗增殖特性, 抑制肿瘤细胞的 IC₅₀ 值为 0.6~8.9 μM。Perifosine 抑制多种细胞生长, 对 K-562, SUDHL-7, HL-60, PC-3, Colo-205 和 MESA-SA (CRL-1976) 的 GI₅₀ 是 11-30 μM, 对 MCF-7, Hos (CRL-1543) 和 LnCAP 细胞的 GI₅₀ >30 μM。Perifosine 通过同时抑制 Akt 蛋白 Thr308 和 Ser473 位点的磷酸化减少 Akt 活性, 介导凋亡作用而抑制乳腺癌, 卵巢癌和前列腺癌细胞的生长。各种肿瘤细胞和移植瘤中, Perifosine 选择性阻止 AKT 聚集到细胞膜从而下调 Akt 及其下游靶蛋白, 尤其是 S6 的磷酸化作用。在人浆细胞瘤小鼠模型中, Perifosine 也表现出显著的抗肿瘤活性, 与肿瘤细胞中 Akt 磷酸化的下调相关。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	KRX-0401; NSC 639966; D-21266; KRX 0401; KRX0401; D21266; D 21266; NSC-639966; NSC639966;
中文名称 (Chinese Name)	哌立福新; 派立福新; (1,1-二甲基哌啶-1-鎓-4-基)十八烷基磷酸酯
靶点 (Target)	Akt
CAS 号 (CAS NO.)	157716-52-4
分子式 (Formula)	C ₂₅ H ₅₂ NO ₄ P
分子量 (Molecular Weight)	461.66
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	不溶于 DMSO, 溶于水
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。不溶于 DMSO, 溶于水。建议分装后-20°C 避光保存, 避免反复冻融。

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) 粉末溶解请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

在 Perifosine 对 PI3K/AKT 信号通路活性的抑制研究中，用 5-10 μM Perifosine 孵育 SKOV3 细胞 4 h，免疫杂交实验表明，Perifosine 降低了 SKOV3 细胞中多种 PI3K/AKT 信号通路成分的基础和 EGF 诱导的磷酸化。^[1] 为检测 Perifosine 对 Akt 磷酸化的抑制作用，分别使用 10 μM Perifosine 处理 MM.1S 细胞 0.5-6 h 和使用 1-10 μM Perifosine 处理 MM.1S 细胞 6 h，结果显示 Perifosine 呈现时间和剂量依赖性的抑制 Akt 磷酸化。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

体内实验中，对无胸腺裸鼠腹腔注射 SKOV3 细胞，7 天后，分别口服 70 mg/kg(3 次)或 200 mg/kg(每周 1 次)Perifosine，结果显示 Perifosine (200 mg/kg) 显著抑制肿瘤生长。^[1]为进一步研究 Perifosine 对人 MM 细胞体内生长的作用，使用免疫缺陷小鼠浆细胞瘤模型，持续 4 周给小鼠口服 250 mg/kg/wk（分为 2 次剂量）和 36 mg/kg/d（单剂量）的 Perifosine，对照用 PBS，结果发现 Perifosine 显著抑制 MM 肿瘤生长。^[2]

参考文献

- [1]. Hennessy, B.T., et al. Pharmacodynamic markers of perifosine efficacy. Clin. Cancer Res. 13: 7421-7431(2007).
- [2]. AEtterna Zentaris, et al. Perifosine Plus Capecitabine Versus Placebo Plus Capecitabine in Patients With Refractory Advanced Colorectal Cancer (X-PECT). ClinicalTrials. gov Identifier: NCT01097018(2010).