

HB221111

## Phenformin hydrochloride 盐酸苯乙福明

### 产品信息

| 产品名称                            | 产品编号      | 规格     |
|---------------------------------|-----------|--------|
| Phenformin hydrochloride 盐酸苯乙福明 | 53423ES76 | 500 mg |

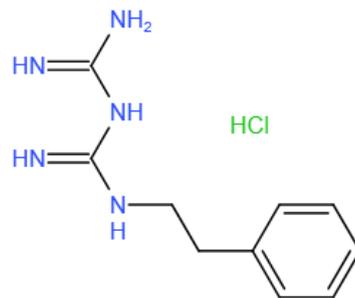
### 产品描述

Phenformin hydrochloride (盐酸苯乙福明, 盐酸苯乙双胍, Phenformin; NSC-756501) 是 Phenformin 盐酸盐形式, 能活化 AMPK, 促进 AMPK 下游靶点 ACC 的磷酸化, 呈剂量依赖性地上调 BRAFV600E Me-1 黑色素瘤细胞中 AMPK 激酶活性。Phenformin/PLX4720 联合用药显著促进凋亡性细胞死亡并抑制肿瘤细胞增殖。

### 产品性质

|                        |                                                  |
|------------------------|--------------------------------------------------|
| 英文别名 (English Synonym) | Phenformin; NSC-756501; NSC756501                |
| 中文名称 (Chinese Name)    | 盐酸苯乙福明; 盐酸苯乙双胍                                   |
| 靶点 (Target)            | AMPK                                             |
| 通路 (Pathway)           | Epigenetics--AMPK                                |
| CAS 号 (CAS NO.)        | 834-28-6                                         |
| 分子式 (Formula)          | C <sub>10</sub> H <sub>16</sub> ClN <sub>5</sub> |
| 分子量 (Molecular Weight) | 241.72                                           |
| 外观 (Appearance)        | 粉末                                               |
| 纯度 (Purity)            | ≥95%                                             |
| 溶解性 (Solubility)       | 溶于 DMSO                                          |

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存, 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. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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）

Phenformin hydrochloride（1, 5 mM; 2 小时）作用于 BRAFV600E Me-1 黑色素瘤细胞和 HEK-293 细胞，Phenformin (1, 5 mM)呈剂量依赖性显著增加 BRAFV600E Me-1 黑色素瘤细胞中 AMPK 激酶活性。在 HEK-293 细胞（作为对照细胞）中，AMPK 激酶活性也出现类似的增加。上述结果表明，BRAFV600E 突变不能阻止黑色素瘤细胞 AMPK 的活化。AMPK 活化是由 AMPK 下游靶点 ACC 的磷酸化增加导致的。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

Phenformin hydrochloride（100 mg/kg; 口服给药; 每天 2 次）处理 4-HT 诱导的携带单一肿瘤的 Tyr::CreER; BRAFCA/+; PTENlox/lox 小鼠，Phenformin 与 PLX4720 联合用药显著抑制小鼠肿瘤生长。单独使用 PLX4720 显著降低肿瘤发展的速度，但单独使用 Phenformin 对肿瘤生长仅有适度的抑制作用。肿瘤免疫组化分析结果表明，Phenformin/PLX4720 联合用药显著促进凋亡性细胞死亡并抑制肿瘤细胞增殖。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

[1] Petti C, et al. AMPK activators inhibit the proliferation of human melanomas bearing the activated MAPK pathway. *Melanoma Res.* 2012 Oct;22(5):341-50.

[2] Yuan P, Ito K, Perez-Lorenzo R, Del Guzzo C, Lee JH, Shen CH, Bosenberg MW, McMahon M, Cantley LC, Zheng B. Phenformin enhances the therapeutic benefit of BRAF(V600E) inhibition in melanoma. *Proc Natl Acad Sci U S A.* 2013 Nov 5;110(45):18226-31.