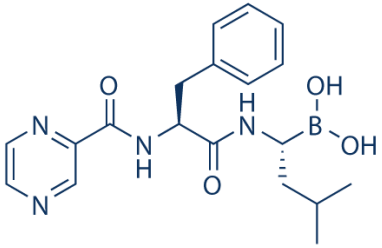


## 硼替佐米；保特佐米；Bortezomib(PS-341)

产品编号：MB1040；  
 质量标准：>99%,BR  
 包装规格：10MG;100MG;1G  
 产品形式：白色至类白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C19H25BN4O4	结构式	
分子量	384.24		
CAS No.	179324-69-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：60 mg/mL 溶于丙酮 几乎不溶于水、无水乙醇		
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。		

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色结晶性粉末  
 熔点：.....139-143 °C  
 溶解性：.....本品溶于 DMSO(60mg/ml)和丙酮，几乎不溶于水、无水乙醇  
 含量：.....≥99.0%  
 IC50：.....20S 蛋白酶体：IC50 = 0.16 nM (小鼠)；A2780：IC50 = 1.7 nM (人)；  
 .....U266：IC50 = 2.45 nM (人)；RPMI18226：IC50 = 3.5 nM (人)；  
 .....HL-60: IC50 = 3.5 nM (human)

### 生物活性

<b>产品描述</b>	硼替佐米; (PS-341)是有效的蛋白酶抑制剂，Ki 为 0.6 nM。它对肿瘤细胞表现出良好的选择性。
<b>靶点</b>	20S proteasome (Cell-free assay) 0.6 nM(Ki)
<b>体外研究</b>	硼替佐米;，一种硼酸二肽，是一种 26S 蛋白酶体的高选择性可逆抑制剂，其作用于错误折叠蛋白的降解，并且对细胞周期的调控是必要的。暴露于硼替佐米;能够稳定 p21，p27，和 p53，以及促凋亡 Bid 和 Bax 蛋白，微囊蛋白-1，和抑制剂 κB-α，这防止了核因子 κB 诱导的细胞存活途径的激活。硼替佐米;也会促进促凋亡 c-Jun-NH2 末端激酶，以及内质网应激反应的激活。这些细胞蛋白水平的改变导致对增殖，迁移的抑制，和癌细胞凋亡的促进。硼替佐米;能够渗透到细胞，并抑制蛋白酶体介导的细胞内长寿蛋白水解，抑制 50%蛋白质水解的浓度为~0.1 μM。硼替佐米;对衍生自美国国家癌症研究所(NCI)多重人类肿瘤的一组 60 个癌细胞系的 IC50 值为 7 nM。PC-3 细胞用硼替佐米; (100 nM)处理 8 小时导致细胞积聚在 G2-M 期，相应的 G1 期细胞数量减少。硼替佐米;在 24 和 48 小时杀死 PC-3 细胞，IC50 分别为 100 和 20 nM。硼替佐米;治疗 16-24 小时后诱导细胞核缩合。硼替佐米;在低至 100 nM 浓度下以时间依赖的方式导致 PARP 裂解，在处理 24 小时后产生效果
<b>体内研究</b>	硼替佐米;单一用药的抗癌作用已在多发性骨髓瘤的异种移植模型，成人白血病，肺癌，乳

腺癌，前列腺癌，胰腺癌，头颈癌，和结肠癌，以及在黑色素瘤中得到证实。在 Lewis 肺癌模型中，口服硼替佐米; (1.0 mg/ kg, 每天)，服用 18 天引起肿瘤生长延迟，并减少转移数量。硼替佐米;单一用药，高达 5 mg/kg 剂量时显著降低乳腺癌细胞的存活率。在前列腺癌小鼠异种移植模型中，硼替佐米; (1.0 mg/kg, 每周一次)用药 4 周减少 60%肿瘤生长。1.0 mg/kg 硼替佐米;给药 4 周导致胰腺癌小鼠异种移植植物生长减少 72%或 84%，并导致肿瘤细胞凋亡增加。1.0 mg/kg 硼替佐米;显著抑制人浆细胞瘤异种移植植物生长，增加肿瘤细胞凋亡和总存活率，并减少肿瘤血管生成
--

**产品用途:** 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

**推荐使用方法：**

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.6025 mL	13.0127 mL	26.0254 mL
5 mM		0.5205 mL	2.6025 mL	5.2051 mL
10 mM		0.2603 mL	1.3013 mL	2.6025 mL
50 mM		0.0521 mL	0.2603 mL	0.5205 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>激酶实验：</b>	动力学法: 在典型的动力学试验中，2.00 mL 试验缓冲液(20 mM HEPES，0.5 mM EDTA，0.035% SDS，pH 7.8) 和 Suc-Leu-Leu-Val-Tyr-AMC 溶于 DMSO，加入 3 mL 荧光比色皿中，并将比色皿放置于荧光分光光度计的夹套细胞皿座。反应温度通过循环水浴维持在 37°C。反应溶液达到热平衡后(5 分钟)，1 μL-10 μL 储存酶溶液加入培养皿。伴随 AMC 从多肽 AMC 底物裂解的反应进程通过 440 nm ( $\lambda_{ex}$ = 380 nm)下荧光发射的增加监测。
<b>细胞实验：</b>	Cell lines: 人多发性骨髓瘤细胞系 U266 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 2 天 Method: 通过测定细胞吸收 MTT 染料的情况而测定 硼替佐米;对 MM 和 BMSC 生长的抑制情况。每孔使用 10 μL 5 mg/mL MTT 对培养 48 小时的细胞进行脉冲处理，至少处理 4 小时，随后加入 100 μL 含 0.04 N HCl 的异丙醇。使用分光光度计在 570 nm 处测定吸光值。
<b>动物实验：</b>	Animal Models: 人浆细胞瘤异种移植植物 RPMI 8226 Formulation: 生理盐水 Dosages: 1mg/kg Administration: i.v.，一周两次，使用 4 周，然后一周一次

**【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 产品分类：**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。