

Clofarabine ; 克罗拉滨 ; 氟法拉滨

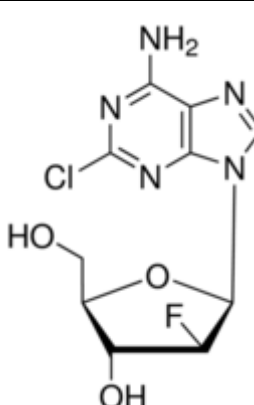
产品编号 : MB1061

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 5MG ; 25MG ; 100MG

产品形式 : 白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C10H11ClFN5O3	结 构 式	
分子量	303.68		
CAS No.	123318-82-1		
储存条件	2-8℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 60 mg/mL (197.57 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: 克罗拉滨 Clofarabine(Clofar; Clofarex)能抑制核苷酸还原酶, IC50 为 65 nM, 还能抑制 DNA 聚合酶活性。

别名: (2R,3R,4S,5R)-5-(6-amino-2-chloropurin-9-yl)-4-fluoro-2-(hydroxymethyl)oxolan-3-ol, 2-chloro-2'-arabino-fluoro-2'-deoxyadenosine ; Clofar ; Clofarex

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

熔点 :202-205 °C(lit.)

溶解性 :DMSO 60 mg/mL (197.57 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

纯度 :>99%,BR

储存条件: 2-8℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

Clofarabine 是一种第二代嘌呤核苷类似物, 目前已被合成, 以克服其局限性, 并结合了氟达滨和 cladribine 的最佳品质。氟法拉滨通过抑制核苷酸还原酶和 DNA 聚合酶的作用, 从而耗尽细胞内用于 DNA 复制的脱氧核苷三磷酸酯的数量。与前体相比, 氟法拉滨对脱氨基和磷解有更强的抵抗力, 因此具有更好的稳定性和对脱氧胞苷激酶(deoxycytidine kinase, dCyd)的更高的亲和力, 后者是核苷酸磷酸化的限速步骤。自 1993 年第一阶段开始, 研究了 clofarabine 在血液学和固体恶性肿瘤患者中的应用, clofarabine 在成人急性白血病(包括急性髓细胞白血病(AML))中显示了单剂抗肿瘤活性。在治疗成人急性髓细胞白血病和骨髓增生异常综合症中具有科研价值。

产品描述	Clofarabine 抑制 ribonucleotide reductase (IC50 = 65 nM)和 DNA 聚合酶的酶活性。
靶点	Ribonucleotide reductase

	(Cell-free assay)
	65 nM
体外研究	<p>Clofarabine 通过两种促进型和平衡型核苷转运蛋白, hENT1 和 hENT2, 以及一种集中型核苷转运蛋白, hCNT253, 有效地转运到细胞内。Clofarabine 被细胞溶质中的激酶逐步磷酸化为核苷类似物 Clofarabine 5'-单-, 双-和三磷酸盐, 然后进入细胞, Clofarabine 三磷酸盐为活性形式。Clofarabine 5'-单-, 双-和三磷酸盐不是核苷转运蛋白的底物, 必须被 5'-核苷酸酶酶促转化为它们的去磷酸化形式转运出细胞。Clofarabine 三磷酸盐是核苷酸还原酶(IC50 = 65 nM)的有效抑制剂, 推测通过调节亚基结合到变构位点。Clofarabine 直接作用于线粒体, 通过改变跨膜电位, 将细胞色素 C, 凋亡诱导因子(AIF), 凋亡蛋白酶活化因子 1 (APAF1)和 caspase 9 释放到细胞质。在多种白血病和实体肿瘤细胞系中, Clofarabine 在体外表现出强的生长抑制作用和细胞毒性(IC50 值= 0.028-0.29 μM)。Clofarabine 能够增加 HL6 细胞中 dCK 的活性, 也能增加 K562 细胞中 ara-C 单-, 双-和三磷酸盐的形成。Clofarabine (10 μM)抑制 4-过氧氢环磷酰胺(4-HC)引起的修复, 在慢性淋巴细胞白血病(CLL)淋巴细胞中, 抑制峰值为 5 μM 细胞内浓度。Clofarabine (10 μM)与 4-过氧氢环磷酰胺(4-HC)结合比各自单独使用能够产生更多的额外凋亡性细胞死亡。Clofarabine (1 μM)与 ara-C (10 μM)结合产生 ara-CTP 的生化调节作用, 并协同杀死 K562 细胞。</p>
体内研究	<p>在无胸腺裸鼠或重症联合免疫缺陷小鼠体内, Clofarabine 腹腔内给药对各种皮下移植的人肿瘤移植植物具有显著的活性。</p>

美仑相关产品推荐

MB12000	Tax8, 人体 T 细胞白血病病毒-1(12-19)
MB12001	Tax9, 人体 T 细胞白血病病毒-1(11-19)

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。

Clofarabine(Clofar;Clofarex 抑制核糖核苷酸还原酶(IC50 = 65 nM)和 DNA 聚合酶的酶活性。氯法拉滨是第二代嘌呤核苷模拟物, 具有抗肿瘤活性。它是细胞内磷酸化, 抑制核苷酸还原酶(IC50 = 65 nM)和 DNA 聚合酶的酶活性, 抑制 DNA 修复和 DNA 和 RNA 合成。这种核苷类似物还破坏线粒体功能和细胞膜完整性, 导致凋亡前因子的释放, 包括细胞色素 C 和促凋亡因子, 这些因子会激活凋亡。氯法拉滨可被用于治疗复发或顽固性急性淋巴细胞白血病(ALL)等科研领域的探索。

储液配置

浓度	质量 / 体积		
	DMSO	1 mg	5 mg
1 mM	3.2929 mL	16.4647 mL	32.9294 mL
5 mM	0.6586 mL	3.2929 mL	6.5859 mL
10 mM	0.3293 mL	1.6465 mL	3.2929 mL
50 mM	0.0659 mL	0.3293 mL	0.6586 mL

【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。