

## 地西他滨；5-氮杂-2'-脱氧胞嘧啶核苷；Decitabine

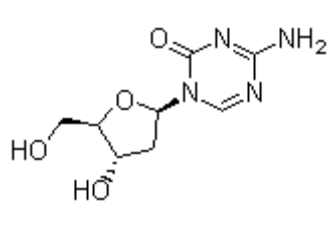
产品编号：MB1075

质量标准：>99%,BR,可用于细胞培养

包装规格：100MG;1G

产品形式：白色或类白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C8H12N4O4	结构式	
分子量	228.20		
CAS No.	2353-33-5		
储存条件	2-8℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 30 mg/mL (197.18 mM) Water 10 mg/mL (43.81 mM) Ethanol Insoluble		
注意事项	遇水迅速降解，最好不要用水做溶剂		
	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：.....白色或类白色结晶性粉末

熔点：.....198℃ ~ 203

溶解性：.....溶于 DMSO 30 mg/mL；略溶于水 10 mg/mL；几乎不溶于乙醇

.....遇水迅速降解，最好不要用水做溶剂

密度：.....1.91 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重：.....≤1.0%

含量：.....98.0-102.0%

IC50：.....DNA 甲基转移酶：IC50 = 4.38 nM (KG1a cells)；

.....DNA 甲基转移酶：IC50 = 438 nM (HL-60 cells)

.....半数致死剂量 (LD50) 腹膜内的 - 老鼠 - 190 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 静脉内的 - 老鼠 - 22 mg/kg

### 生物活性

产品描述	Decitabine 是 DNA 甲基转移酶抑制剂，整合进入 DNA、导致 DNA 低甲基化，并使 DNA 复制停滞在 intra-S-phase。Decitabine 被用于治疗骨髓增生异常综合征(MDS)。
特性	Decitabine 是 DNA 甲基化的有效抑制剂。
靶点	DNA methylation (HL-60, KG1a cells)



<b>体外研究</b>	Decitabine 有效抑制 DNA 合成, 这种作用存在剂量依赖性, 作用于 HL-60 和 KG1a 白血病细胞时, IC50 分别为 100 ng/mL 和 1 ng/mL。Decitabine 抑制细胞生长, 这种作用存在剂量和时间依赖性, 处理 HL-60 和 KG1a 白血病细胞 72 小时和 96 小时, IC50 分别约为 100 ng/mL 和 10 ng/mL。最新研究显示 Decitabine 作用于间变性大细胞淋巴瘤(ALCL), 具有抗增殖和促凋亡活性, 且抑制 KARPAS-299 细胞中 <sup>[3H]</sup> 胸甘的摄取, EC50 为 0.49 μM。
<b>体内研究</b>	Decitabine 按 2.5 mg/kg 剂量作用于 ALK+ KARPAS-299 小鼠移植瘤模型, 促进凋亡, 且降低肿瘤细胞增殖, 也导致肿瘤抑制基因 p16INK4A 的去甲基化。

**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。地西他滨作为特异的 DNA 甲基化转移酶抑制剂, 可逆转 DNA 的甲基化过程, 诱导肿瘤细胞向正常细胞分化或诱导肿瘤细胞凋亡。在肿瘤细胞内, 地西他滨被脱氧胞苷激酶磷酸化, 以磷酸盐的形式与 DNA 掺合。高浓度的地西他滨掺合可抑制 DNA 合成诱导细胞死亡, 发挥其细胞毒作用; 低浓度的地西他滨掺合可替代肿瘤细胞内的胞嘧啶与 DNA 甲基化转移酶共价结合, 使 DNA 甲基化转移酶失活但不会导致细胞死亡。

**使用方法推荐:**

**储液配置**

体 积 / 浓度 \ 质 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.3819 mL	21.9096 mL	43.8193 mL
5 mM	0.8764 mL	4.3819 mL	8.7639 mL
10 mM	0.4382 mL	2.1910 mL	4.3819 mL
50 mM	0.0876 mL	0.4382 mL	0.8764 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验:</b>	DNA 合成检测: 通过测定放射性胸甘摄入到 DNA 的情况而测定 DNA 合成比率。HL-60 和 KG1a 细胞悬浮在 6 孔(直径为 35 mm) 盘中, 孔中为含 10%胎牛血清的 2 mL RPMI 培养基中, 然后与不同浓度相应药物温育 48 小时 (药物同时加入)。48 小时时, 每孔加入 0.5 μCi [ <sup>3</sup> H] 胸甘(6.7 Ci/mmol), 再温育 24 小时。细胞置于 GF/C 玻璃纤维过滤器(直径为 2.4 cm)中, 使用冷 0.9% NaCl, 5% 冷三氯乙酸和乙醇清洗。烘干含 DNA 的过滤器, 置于 EcoLite 闪烁液(ICN)中, 使用 Beckman LS 6000IC 闪烁计数器测量放射性。通过剂量-反应曲线计算 IC50 值。
<b>细胞实验:</b>	Cell lines: HL-60 和 KG1a Concentrations: 0 到 100 ng/mL Incubation Time: 96 小时 Method: 生长抑制实验中, 指数生长期细胞接种在 5 ml 培养基中。向培养基中同时加入不同浓度 Decitabine。在指定时间, 使用模型 ZM Coulter 计数器对细胞进行计数。根据药物处理的白血病细胞的生长曲线, 测定 IC50 值。
<b>动物实验:</b>	Animal Models: KARPAS-299 人类细胞皮下接种到小鼠的左右两侧。



	Formulation: Decitabine 溶于无菌 PBS Dosages: $\leq 2.5$ mg/kg Administration: 腹腔注射
--	---

**【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。

