

多烯紫杉醇无水；多西他赛；Docetaxel anhydrous

产品编号：MB1081

质量标准：purity>99.0%,BR

包装规格：100MG;1G;5G

产品形式：白色或类白色结晶性粉末 基

本信息

分子式	C43H53NO14	结构式	
分子量	807.88		
CAS No.	114977-28-5		
储存条件	2-8℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	乙醇：30mg/ml		
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：.....白色或类白色结晶性粉末。

溶解性：.....乙醇：30mg/ml。

含量：..... > 99.0%

生物活性

产品描述	Docetaxel，一种 taxol 类似物，是一种 microtubules 解聚抑制剂，通过结合于稳定的微管发挥作用。
靶点	Microtubules(Cell-free assay)
体外研究	Docetaxel 是一种细胞毒性剂，尤其对于增殖细胞，Docetaxel 促进微管蛋白束的形成，还能诱导持续的有丝分裂阻滞，随后分裂阻滞的细胞凋亡或永久抑制分裂。Docetaxel 抑制微管的动态不稳定性及踏车现象，导致染色体不能分开到子细胞中，这样又会反过来触发有丝分裂过早结束，而不是在细胞周期的特定时期进行抑制作用。Docetaxel (150 ng/mL) 处理人类小细胞肺癌 N417 细胞系 1 小时，抑制 50% 细胞生长。Docetaxel 处理 KB 人类表皮癌细胞, T24 人类膀胱癌细胞, Calc18 人类乳腺癌细胞, 和 HCT116 人类结肠腺癌 96-120 小时, IC50 值分别为 8 ng/mL, 4 ng/mL, 5 ng/mL, 和 7 ng/mL。Docetaxel 处理人类癌细胞 Hs746T (胃), AGS (胃), HeLa (子宫颈), CaSki (子宫颈), BxPC3 (胰腺), Capan-1 (胰腺)

	24 小时，抑制克隆存活，IC50 分别为 1 nM, 1 nM, 0.3 nM, 0.3 nM, 0.3 nM, 0.3 nM。通过克隆形成实验测评 Docetaxel 处理人类 卵巢癌细胞系 OVCA432, A2780, A2780/cp8 12 天期间，IC50 值分别达到 0.06 nM, 0.6 nM, 和 3 nM。Docetaxel 作用于 9 种培养的人类胃癌细胞系 (MKN-7, -28, -45, NUGC-4 和 KATO-III, ST-SA-1, NAKAJIMA 和 ST-KM, KKLS) 时，IC50 分别为 >1.2 μM, 0.6 nM, 0.1 nM, 3.5 nM, 4 nM, 99 nM, 0.3 nM, 0.5 nM, 0.9 nM。在体外，Docetaxel 在极低浓度时，抑制内皮细胞迁移，这并不影响微管的大体形态或抑制细胞增殖，对微管动力学产生更微妙的影响。Docetaxel 抑制 HUVEC 迁移，IC50 为 1 pM。Docetaxel 抑制血管生成因子胸苷磷酸化酶或血管内皮生长因子刺激的 HUVEC 趋化性，IC 50 为 10 pM 。Docetaxel (30 μM) 在添加 10% 人血清的培养基中温育 12 小时，诱导人单核细胞。
体内研究	Docetaxel (33 mg/kg/dose, 静脉注射，每四天注射 3 次) 处理 M2OL2 结肠移植瘤，结果肿瘤生长延迟 19.3。Docetaxel 作用于 MX-1, SK-MEL-2, LX-1 和 OVCAR-3 移植瘤，也具有很强的抗肿瘤活性。Docetaxel 抑制成纤维细胞生长因子 2 的血管反应，IC50 为 5.4 mg/kg，Docetaxel 按 10 mg/kg 剂量处理小鼠，在 14 天期间，每周注射两次，结果血管完全堵塞。Docetaxel 对内皮细胞迁移和/或微血管形成具有选择性，因为炎症细胞浸润到基底膜对 Docetaxel 抑制不太敏感。

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。本品属于紫杉类化合物抗肿瘤药。本品的作用机制是加强微管蛋白聚合作用和抑制微管解聚作用，导致形成稳定的非功能性微管束，因而破坏肿瘤细胞的有丝分裂。本品在细胞内浓度比紫杉醇高 3 倍，并在细胞内滞留时间长，这是本品在体外试验中比紫杉醇抗肿瘤活性大的重要原因。在体内试验中，对小鼠的结肠癌、乳腺癌、肺癌、卵巢肿瘤移植植物等有效。对顺铂、足叶乙苷、5Fu、或紫杉醇耐药的细胞株，本品不产生交叉耐药。

使用方法推荐：

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.2378 mL	6.1890 mL	12.3781 mL
5 mM	0.2476 mL	1.2378 mL	2.4756 mL
10 mM	0.1238 mL	0.6189 mL	1.2378 mL
50 mM	0.0248 mL	0.1238 mL	0.2476 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验：	Cell lines: 人类胃癌细胞系 MKN-28 Concentrations: 6 nM Incubation Time: 3 天 Method: 180 μL 培养基中的 2000 个细胞接种到 96 孔板中，20 μL 药物溶液同时按一式三份加到每孔中。实验板在 37°C 下含 5% CO2 的培养箱中温育 3 天。在第 3 天，每孔加入 25 μL MTT 试剂。温育 4 小时后，除去培养基。每孔加入 0.2 mL DMSO，使用机械式搅拌机充分混合，溶解形成的 MTT-甲臞晶体。在 540 nm (OD) 处测定吸光值。
--------------	---

动物实验：	Animal Models: 携带人类结肠癌移植瘤 CX-1 的小鼠 Formulation: 50 mg/mL 储存液溶于乙醇, 加入同等体积的聚山梨酯 80, 然后使用 溶于水的 5% 葡萄糖稀释到最终体积。 Dosages: 33 mg/kg Administration: 静脉注射, 每四天注射 3 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。

部分客户使用美仑产品发表文献举例

- Shrapnel nanoparticles loading docetaxel inhibit metastasis and growth of breast cancer.
Novel folate-targeted docetaxel -loaded nanoparticles as tumour targeting: in vitro and vivo evaluation.
- Matrix metalloproteinases-2/9-sensitive peptide-conjugated polymer micelles for site-specific release of drugs and enhancing tumor accumulation: preparation and in vitro and in vivo evaluation.
- Fluorescence resonance energy transfer between ZnSe-ZnS quantum dots and bovine serum albumin in bioaffinity assays of anticancer drugs.
- Dual Stimuli-Responsive Hybrid Polymeric Nanoparticles Self- Assembled from POSS-Based Star-Like Copolymer-Drug Conjugates for Efficient Intracellular Delivery of Hydrophobic Drugs. Subcellular co-delivery of two different site-oriented payloads for tumor therapy.
- A Smart Responsive Dual Aptamers-Targeted Bubble-Generating Nanosystem for Cancer Triplex Therapy and Ultrasound Imaging.
- The targeted co-delivery of DNA and doxorubicin to tumor cells via multifunctional PEI-PEG based nanoparticles.

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。