

多烯紫杉醇无水/多西他赛

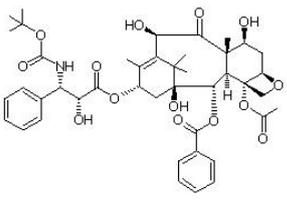
产品编号: MB1081

质量标准: >99%,BR

包装规格: 100mg /1g / 5g / 25g

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₄₃ H ₅₃ NO ₁₄	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		
运输条件	常温运输		

简介: 多西他赛是一种 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。

别名: Docetaxel anhydrous

物理性状及指标:

外观:白色或类白色结晶粉末

溶解性:几乎不溶于水, 可溶于无水乙醇, 易溶于二氯甲烷

含量:>99%,BR

干燥失重:NMT1.0%

生物活性:

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 (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, IC ₅₀ 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, IC ₅₀ 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, IC ₅₀ 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, IC ₅₀ 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。
体内研究	Docetaxel (33 mg/kg/dose, 静脉注射, 每四天注射 3 次) 处理 M20L2 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, IC ₅₀ 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。

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、卵巢肿瘤移植瘤等有效。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。



经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	<p>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-甲臜晶体。在 540 nm (OD)处测定吸光值。</p>
动物实验	<p>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</p>

储液配制:

体 浓度	质量 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

【注意】

- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献:

- [1] Riou J F, Naudin A, Lavelle F. Effects of Taxotere on murine and human tumor cell lines[J]. Biochemical and biophysical research communications, 1992, 187(1): 164-170.
- [2] Balcer-Kubiczek E K, Attarpour M, Jiang J, et al. Cytotoxicity of docetaxel (Taxotere®) used as a single agent and in combination with radiation in human gastric, cervical and pancreatic cancer cells[J]. Chemotherapy, 2006, 52(5): 231-240.
- [3] Silvestrini R, Zaffaroni N, Orlandi L, et al. In vitro cytotoxic activity of Taxol and Taxotere on primary cultures and established cell lines of human ovarian cancer[J]. Stem Cells (Dayton, Ohio), 1993, 11(6): 528-535.
- [4] Tanaka M, Obata T, Sasaki T. Evaluation of antitumour effects of docetaxel (Taxotere®) on human gastric cancers in vitro and in vivo[J]. European Journal of Cancer, 1996, 32(2): 226-230..
- [5] Moos P J, Muskardin D T, Fitzpatrick F A. Effect of taxol and taxotere on gene expression in macrophages: induction of the prostaglandin H synthase-2 isoenzyme[J]. The Journal of Immunology, 1999, 162(1): 467-473.

J250602

