

盐酸伊达比星 ; IdarubicinHCl

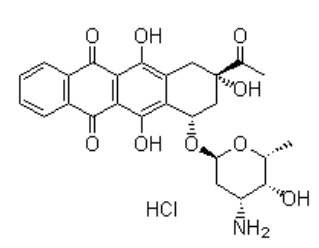
产品编号 : MB1121

质量标准 : 纯度 > 98%, BR

包装规格 : 5MG; 20MG

产品形式 : 红橙色或红棕色粉末

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₂₇ NO ₉ ·HCl	结构式	
分子量	533.95		
CAS No.	57852-57-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥。		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (187.28 mM) Water : 5 mg/mL warmed (9.36 mM) 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。		

物理性状及指标 :

外观 :红橙色或红棕色粉末

溶解性 :溶于 DMSO 100mg/ml ; 微溶于水 5 mg/mL (加热); 几乎不溶于乙醇

含量 :960~1030ug/mg; 纯度 > 98%

生物活性

产品描述	Idarubicin HCl 是蒽环类抗生素 Idarubicin 的盐酸盐形式, 抑制 MCF-7 细胞中的 DNA 拓扑异构酶 II (topo II), 无细胞试验中 IC ₅₀ 为 3.3 ng/mL。	
特性	Idarubicin 是一种 CYP450 2D6 和 2C9 的底物。	
靶点	Topo II (MCF-7 cells) (Cell-free assay) 3.3 ng/mL	Multicellular spheroids (Cell-free assay) 7.9 ng/mL
体外研究	Idarubicin 对多细胞球体具有显著的细胞毒性, 比得上对单层细胞的抗增殖作用。Idarubicin 抑制 CYP450 2D6。Idarubicin 分别比 doxorubicin 和 epirubicin 有效 57.5 倍和 25 倍。Idarubicin 能够克服 P-糖蛋白介导的多药耐药性。Idarubicin 抑制 PMN 超氧游离基的形成。Idarubicin 能够耦合到单克隆抗体(抗-Ly-2.1, 抗-L3T4, 或抗-Thy-1), 并且保留蛋白质溶解度和抗体活性。Idarubicin 抑制 NALM-6 细胞的增殖, IC ₅₀ 为 12 nM。	
体内研究	Idarubicin 的还原取决于酮还原酶, 产生比大多数酮更高的立体选择性, 引起几乎完全的 (1S)-差向异构。Idarubicin 还原的高立体选择性可能是由于 Idarubicin 结构中靠近羰基的不对称中心存在下, 手性诱导导致的	

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。本药为蒽环类抗生素, 有抗有丝分裂和细胞毒作用。盐酸伊达比星为柔红霉素类似物, 因蒽环第 4 位缺少一个甲氧基, 故比柔红霉素的脂溶性高, 更易透过细胞膜。盐酸伊达比星可抑制核酸合成, 干扰拓扑异构酶 II

使用方法推荐 :

储液配置

体 浓度 质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8728 mL	9.3642 mL	18.7283 mL
5 mM	0.3746 mL	1.8728 mL	3.7457 mL
10 mM	0.1873 mL	0.9364 mL	1.8728 mL
50 mM	0.0375 mL	0.1873 mL	0.3746 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>CYP450 代谢实验:</p> <p>Idarubicin 被 CYP450 同工酶 3A4, 2D6, 2C8, 2C9, 和 1A2 代谢的评估, 使用对应每种亚型的离体人 CYP450 蛋白质完成。高通量 P450 抑制检测方法用于这些评估。设计代谢实验以探究药物以下的性能: (1) Idarubicin 是否作为一种 CYP450 3A4, 2C8, 2C9, 1A2 或 2D6 同工酶的底物; (2) 代谢是否被每种同工酶的已知抑制剂影响; (3) Idarubicin 是否为 CYP450 同工酶的抑制剂; 以及(4) Caspofungin 或 itraconazole 是否抑制 Idarubicin 的 CYP450 代谢。Dibenzylfluorescein (DBF)(CYP3A4, CYP2C8, CYP2C9), 3-cyano-7-ethoxycoumarin (Cyp1A2), 和 7-methoxy-4-(aminomethyl)-coumarin (MAMC) (CYP2D6)是已知的用作对照组的底物, 以证实每种同工酶的活性, 并评估 Idarubicin 对同工酶活性的作用。此外, ketoconazole, quercetin, suflaphenazole, furafylline, 和 quinidine 分别用作 3A4, 2C8, 2C9, 1A2 或 2D6 同工酶的对照 CYP450 抑制剂。如上所诉的底物, 抑制剂和 Idarubicin 加入每个蛋白质样品中, 根据制造商的建议在 37°C下培养 20 到 60 分钟。加入有机溶剂停止反应, 然后样品通过适当的荧光酶标仪分析。对每个实验, 同工酶不存在下, 制备对照试样与已知量的底物以及合成的代谢物用于定性比较。所有实验以一式三份进行。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: NALM-6 细胞</p> <p>Concentrations: 0.1 nM-10 μM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method: 复合物中的 Idarubicin 相比于游离药物的抗增殖活性通过[3H]胸苷摄取的抑制测量。简而言之, NALM-6 细胞(1.5×10^6/mL)加入平底微量滴定板(100 μL/well), 在 37°C 下培养 1 小时。游离 Idarubicin 和 Idarubicin-mAb 复合物过滤灭菌并在无菌 PBS 中稀释, 以不同浓度重复 3 份加入孔中(100 μL/well), 板在 37°C, 7% CO₂ 下培养 24 小时。培育后, 50 μL 包含 1 μCi [3H]胸苷的培养基加入每孔中, 板进一步培养 4 小时。将细胞采集到玻璃纤维滤纸上, 干燥, 并在闪烁计数器上计数。特异性研究使用相同的技术进行, 比较 Idarubicin-抗-CD19 偶联物杀死 CD19 + 细胞的能力与不相关的 Idarubicin-JGT 偶联物的细胞毒性。NALM-6 细胞 (1.5×10^6/mL, 300 μL 试管) 与不同浓度的 Idarubicin-抗-CD 19 或 Idarubicin-JGT 偶联物在冰浴中培育 30 分钟。然后在冰预冷的 RPMI-1640 培养基(4 mL/wash)中洗涤 3 次, 细胞重悬浮在新鲜培养基中, 并转移到 96 孔板(100 μL/well)。每个试管重复两份建立, 并且每管采集两孔(每个药物浓度一共 4 孔)。细胞用[3H]胸苷脉冲处理 24 小时, 然后采集。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 大鼠, 兔子, 小鼠, 狗</p> <p>Formulation: 生理盐水</p>

	Dosages: 2 mg/kg , 0 mg/kg -75 mg/kg , 3 mg/kg 和 0 mg/kg -75 mg/kg Administration: 静脉注射给药
--	--

【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。