

三水盐酸伊立替康; CPT-11; Irinotecan HCl Trihydrate

产品编号: MB1126

质量标准: >99%,BR,三水合物

包装规格: 200MG;1G

产品形式: solid

基本信息

分子式	C33H38N4O6·HCl·3(H2O)	结 构 式	
分子量	677.19		
CAS No.	136572-09-3		
储存条件	2-8℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 50mg/mL Water: 5 mg/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:淡黄色或黄色结晶性粉末

溶解性:溶于 DMSO50mg/mL, 水 5mg/mL

含量:>99%

生物活性

产品描述	Irinotecan HCl Trihydrate 通过抑制 Topoisomerase 1 (拓扑异构酶 1) 而防止 DNA 解链。
特性	Irinotecan 是一种用于治疗转移性结直肠癌的前药。
靶点	Topo I
体外研究	Irinotecan 被羧酸酯酶活化为 SN-38, 从而能够与其靶点, 拓扑异构酶 I 相互作用。IC50 浓度下的 Irinotecan 在 LoVo 细胞和 HT-29 细胞系中诱导相似量的可裂解复合物。SN-38 诱导可裂解复合物浓度依赖性形成, 这在 LoVo 细胞和 HT-29 细胞系中没有明显差异。Irinotecan 引起的细胞积聚显著不同, 在 HT-29 细胞中的水平始终高于 LoVo 细胞。Irinotecan 的内酯 E 环和 SN-38 在水溶液中可逆水解, 内酯形式和羧酸盐形式之间的互变取决于 PH 和温度。Irinotecan 主要通过肝脏活化为 SN-38。对于相同浓度的 Irinotecan 和 SN-38 葡萄糖苷酸, 在肿瘤和正常组织中, β-葡萄糖醛酸酶介导的 SN-38 产率均高于 Irinotecan 形成的 SN-38 产率。Irinotecan 在肠道, 血浆和肿瘤组织中转化为 SN-38。Irinotecan 在 SCLC 细胞系中的活性显著高于 NSCLC 细胞系, 而在组织学分型中没有观察到 SN-38 有明显的差异。
体内研究	在 COLO320 异种移植瘤中, Irinotecan 诱导 92% 的最大生长抑制。单剂量 Irinotecan 显著增加胃, 十二指肠, 结肠和肝脏中拓扑异构酶 I 与 DNA 的共价结合数量。同时, 与对照组相比, Irinotecan 治疗组的结肠黏膜细胞中 DNA 链断裂数量明显较高。

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。伊立替康是喜树碱的半合成衍生物。喜树碱可特异性地与拓扑异构酶 I 结合, 后者诱导可逆性单链断裂, 从而使 DNA 双链结构解旋; 伊立替康及其活性代谢物 SN-38 可与拓扑异构酶 I-DNA 复合物结合, 从而阻止断裂单链的再连接。现有研究提示, 伊立替康的细胞毒作用归因于 DNA 合成过程中, 复制酶与拓扑异构酶 I-DNA 一伊立替康 (或

SN-38) 三联复合物相互作用, 从而引起 DNA 双链断裂。哺乳动物细胞不能有效地修复这种 DNA 双链断裂。

使用方法推荐:

储液配置

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.4767 mL	7.3836 mL	14.7671 mL
5 mM	0.2953 mL	1.4767 mL	2.9534 mL
10 mM	0.1477 mL	0.7384 mL	1.4767 mL
50 mM	0.0295 mL	0.1477 mL	0.2953 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: LoVo 和 HT-29 细胞</p> <p>Concentrations: 0 μM -100 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method:</p> <p>指数生长的细胞(LoVo 和 HT-29 细胞)以每种细胞系的最佳接种数量(LoVo 细胞 2×10^4; HT-29 细胞 10^5)接种于 20 cm² Petri 培养皿。2 天后, 用逐渐增加浓度的 Irinotecan 或 SN-38 处理一个细胞倍增时间(LoVo 细胞 24 小时, HT-29 细胞 40 小时)。0.15 M NaCl 洗涤后, 细胞进一步在正常培养基中生长两个倍增时间, 从胰蛋白酶-EDTA 的支撑物中分离, 并在血细胞计数器上计数。IC50 值的估算如下: 与不含 Irinotecan 或 SN-38 培养的细胞相比, 引起 50% 生长抑制的 Irinotecan 或 SN-38 浓度。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 负荷 COLO 320 和 WiDr 异种移植物的雌性裸鼠</p> <p>Formulation: 0.9% NaCl</p> <p>Dosages: 20 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</p>

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。