

## 甲氨蝶呤; Methotrexate

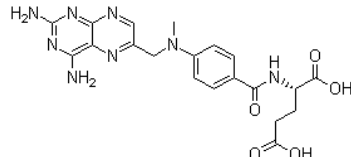
产品编号: MB1156

质量标准: >99%,BR

包装规格: 1G;5G

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C20H22N8O5	结 构 式	
分子量	454.44		
CAS No.	59-05-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	易溶于稀碱溶液 DMSO 90 mg/mL warmed (198.04 mM) 溶于稀盐酸 几乎不溶于水、乙醇、氯仿和乙醚		
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: .....黄褐色或黄色结晶性粉末

溶解性: .....易溶于稀碱溶液、DMSO 90 mg/mL; 溶于稀盐酸; 几乎不溶于水、乙醇、氯仿和乙醚。

密度: .....1.54 g/cm<sup>3</sup> (预测)

含量: .....>99%

IC50: .....二氢叶酸还原酶: IC50 = 6.6 nM (Escherichia coli K-12);

.....核受体共激活剂 3: IC50 = 210.97 nM (Homo sapiens);

.....CCRF-CEM (T-cell leukemia): EC50 = 12.5 nM (Homo sapiens)

### 生物活性

产品描述	Methotrexate (MTX), 一种叶酸类似物, 是细菌、癌细胞和正常细胞 dihydrofolate reductase(DHFR)的非选择性抑制剂, 与 DHFR、NADPH 形成无活性的三元复合物。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>hDHFR (Activated peripheral T cells)</td> </tr> <tr> <td>24 nM</td> </tr> </table>	hDHFR (Activated peripheral T cells)	24 nM
hDHFR (Activated peripheral T cells)			
24 nM			
体外研究	Methotrexate (0.1-10 mM)诱导体外活化的来自人类外周血的 T 细胞的细胞凋亡。在混合淋巴细胞反应中, Methotrexate 使活化的 T 细胞的克隆缺失。Methotrexate 能够通过 CD95 不依赖的途径选择性删除活化的外周血中 T 细胞。Methotrexate 通过还原性叶酸载体被细胞利用, 随后在细胞内被转化为聚谷氨酸盐。Methotrexate 导致体外中性粒细胞刺激的白三烯 B <sub>4</sub> 的产生减少。Methotrexate 聚谷氨酸盐抑制 5-氨基咪唑-4-氨基甲酰核糖核苷 (AICAR)甲酰基转移酶, 比其他参与嘌呤生物合成的酶更加有效。Methotrexate 也通过抑制体外 TNF 诱导的核因子 κB 活化而抑制 TNF 活性, 与该因子, IκBα 的一个抑制剂的降解和活化的减少部分相关, 也可能与腺苷的释放有关。Methotrexate 通过来自健康人体和 RA 患者的 T 细胞受体激活的 T		



	淋巴细胞抑制 TNF 和 IFN- $\gamma$ 的产生。Methotrexate 的治疗与 TNF- $\alpha$ 阳性的 CD4+ T 细胞显著减少，而 T 细胞表达的抗炎因子 IL-10 的数量增加有关。
体内研究	在小鼠体内，Methotrexate 增加脾细胞中 AICAR 含量，升高了角叉菜胶发炎气泡的渗出液中腺苷浓度，并且显著抑制了发炎气泡中白血球的积累。在小鼠体内，Methotrexate 介导的白血球积累的减少被注射腺苷脱氨酶 (ADA) 到气泡而部分逆转，被特定的腺苷 A2 受体拮抗剂，3,7-dimethyl-1-propargylxanthine (DMPX) 完全逆转，但不会被腺苷 A1 受体拮抗剂，8-cyclopentyl-dipropylxanthine 所影响。

#### 美仑相关产品推荐

MB1156-S	甲氨蝶呤 (标准品)
----------	------------

**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。四氢叶酸是在体内合成嘌呤核苷酸和嘧啶脱氧核苷酸的重要辅酶，本品作为一种叶酸还原酶抑制剂，主要抑制二氢叶酸还原酶而使二氢叶酸不能还原成有生理活性的四氢叶酸，从而使嘌呤核苷酸和嘧啶核苷酸的生物合成过程中一碳基团的转移作用受阻，导致 DNA 的生物合成受到抑制。此外，本品也有对胸腺核苷酸合成酶的抑制作用，但抑制 RNA 与蛋白质合成的作用则较弱，本品主要作用于细胞周期的 S 期，属细胞周期特异性药物，对 G1/S 期的细胞也有延缓作用，对 G1 期细胞的作用较弱。

#### 储液配置

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2005 mL	11.0026 mL	22.0051 mL
5 mM	0.4401 mL	2.2005 mL	4.4010 mL
10 mM	0.2201 mL	1.1003 mL	2.2005 mL
50 mM	0.0440 mL	0.2201 mL	0.4401 mL

#### 【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。

#### 部分客户使用美仑产品发表文献举例

- Multiple drug transporters mediate the placental transport of sulphiride.
- Fluorescence resonance energy transfer between ZnSe-ZnS quantum dots and bovine serum albumin in bioaffinity assays of anticancer drugs.



## 活性化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。

