

紫杉醇 ; Paclitaxel

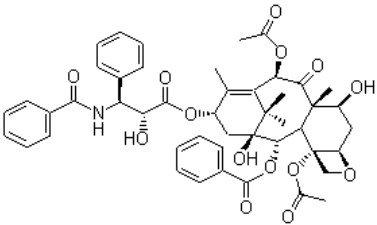
产品编号 : MB1178

质量标准 : >99%,BR,用于细胞培养,药剂造模

包装规格 : 200MG;1G;5G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C47H51NO14	结构式	
分子量	853.92		
CAS No.	33069-62-4		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 171 mg/mL (200.25 mM) Ethanol : 10 mg/mL 溶于甲醇、乙醇、三氯甲烷 在乙醚中微溶, 在水中几乎不溶		
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。		

简介 : 本品为有丝分裂抑制剂。

物理性状及指标 :

外观 :本品为白色或类白色结晶性粉末。

溶解性 :DMSO 171mg/ml; ethanol 10mg/ml.本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解, 在乙醚中微溶, 在水中几乎不溶。

美仑紫杉醇优势 : 紫杉醇为美仑生物自主研发生产的主要产品之一, 大量出口和销售给国内外科研单位使用, 库存充足, 纯度高, 批次稳定, 截止到目前使用美仑紫杉醇发表 SCI 文章数量已经超过 200 篇。其中 10 分以上文章数篇。

相关产品推荐 : DiR 碘化物 (MB12482); -荧光素钾盐(MB1834)

药理作用 : 本品是新型抗微管药物, 通过促进微管蛋白聚合抑制解聚, 保持微管蛋白稳定, 抑制细胞有丝分裂。

体外实验证明紫杉醇具有显著的放射增敏作用, 可能是使细胞中止于对放疗敏感的 G2 和 M 期。

在人内皮细胞中 IC50 为 0.1 pM。Paclitaxel 在 104 到 105 倍更高浓度时, 抑制非内皮性人类细胞, IC50 为 1 nM -10 nM。Paclitaxel 选择性抑制细胞增殖, 具有种属特异性, 在 Paclitaxel 极低浓度时, 小鼠内皮细胞对 Paclitaxel 不敏感。极低浓度 Paclitaxel 抑制人类内皮细胞, 但是不影响细胞微管结构, 且处理的细胞在 G2/M 期没有出现细胞周期停滞和凋亡, 说明这是一种新型尚未查明的作用机制。在体外血管生成实验中, 在三维纤维蛋白基质中, 极低浓度 Paclitaxel 阻断人类内皮细胞形成芽管。在 SMF 存在时, Paclitaxel 作用于 K562 细胞的有效浓度从 50 ng/ml 降低到 10 ng/ml。在有或无 SMF 时, Paclitaxel 使 K562 细胞周期停滞与 DNA 损伤相关。Paclitaxel 单独处理四种细胞系, 包括 A549 细胞, H358, H1395 细胞和 H1666 细胞, 抑制 CDK1, 这种作用存在时间依赖性

生物活性

产品描述	Paclitaxel 是一种 microtubule 聚合物稳定剂, 在人内皮细胞中 IC50 为 0.1 pM。
------	---

特性	Paclitaxel 是有丝分裂抑制剂。
靶点	Microtubule (human endothelial cells) 0.1 pM
体外研究	Paclitaxel 在 10 ⁴ 到 10 ⁵ 倍更高浓度时, 抑制非内皮性人类细胞, IC ₅₀ 为 1 nM -10 nM。Paclitaxel 选择性抑制细胞增殖, 具有种属特异性, 在 Paclitaxel 极低浓度时, 小鼠内皮细胞对 Paclitaxel 不敏感。极低浓度 Paclitaxel 抑制 人类内皮细胞, 但是不影响细胞微管结构, 且处理的细胞在 G ₂ /M 期没有出现细胞周期停滞和凋亡, 说明这是一种新型尚未查明的作用机制。在体外血管生成实验中, 在三维纤维蛋白基质中, 极低浓度 Paclitaxel 阻断人类内皮细胞形成芽管。在 SMF 存在时, Paclitaxel 作用于 K562 细胞的有效浓度从 50 ng/ml 降低到 10 ng/ml。在有或无 SMF 时, Paclitaxel 使 K562 细胞周期停滞与 DNA 损伤相关。Paclitaxel 单独处理四种细胞系, 包括 A549 细胞, H358, H1395 细胞和 H1666 细胞, 抑制 CDK1, 这种作用存在时间依赖性。
体内研究	Paclitaxel 单独处理 BC-V 和 BC-ER 肿瘤的抑制定额分别为 49.78 和 51.23%。20 mg/kg Paclitaxel 处理 6 个周期, 显著降低 Ki-67 阳性细胞百分比, BC-V 肿瘤中降到 20.4%, BC-ER 肿瘤中降到 25.1%。

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。药理活性筛选, 纳米材料, 载药体系研究, 紫杉醇为经典的疏水药物。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.1711 mL	5.8554 mL	11.7108 mL
5 mM		0.2342 mL	1.1711 mL	2.3422 mL
10 mM		0.1171 mL	0.5855 mL	1.1711 mL
50 mM		0.0234 mL	0.1171 mL	0.2342 mL

经典实验操作 (仅供参考)

一: CCMC 组装纳米胶束紫杉醇药物释放载体

以 N-胆甾醇琥珀酰基-O-羧甲基壳聚糖(CCMC,胆甾醇基取代度 6.9%)为原料,在水溶液中制备其自组装凝胶纳米胶束,采用稳态荧光探针法考察临界胶束浓度。

取一定量 CCMC 分散于去离子水中,在 37°C,50 r/min 条件下振荡 48h,然后进行探头超声处理 3min(输出功率 100W,间歇脉冲方式,脉冲宽度 2.0S,间歇时间 2.0S),重复操作至获得均一分散液,经滤膜(0.45 um)过滤除去杂质,即得 CCMC 自组装纳米胶束。在超声条件下向空白胶束溶液中缓慢滴加紫杉醇甲醇溶液,置于透析袋内,于去离子水中透析处理 8h,除去甲醇,即得负载紫杉醇的 CCMC 自组装纳米胶束。空白和载药 CCMC 自组装纳米胶束的粒径及分布用动态光发射法(LLS,氦离子激光器)在 25°C,波长 532nm,动态光散射角为 90 度的条件下检测。

二: 紫杉醇磁性脂质体制备

采用薄膜超声法制备紫杉醇磁性脂质体。卵磷脂(187mg);胆固醇(39mg);紫杉醇(10MG)溶于 5mL 无水乙醇溶剂中,得到脂质体溶液,在 55°C 水浴条件下旋转蒸发制成均匀薄膜,继续 55°C 水浴减压蒸发 30min 出去无水乙醇,得到稠厚的胶状物。加入谷氨酸修饰的磁性三氧化二铁纳米颗粒(nano-Fe₂O₃-Glu)磁流体

2.15ml(13.70g/L)及 5%葡萄糖溶液 2.85mL,手摇振荡使器壁上的凝胶脱落, 超声处理 20min,得到紫杉醇磁性脂质体混悬液。

三：负载紫杉醇的 PEG/PCL 共聚物纳米粒制备

紫杉醇聚合物纳米粒(PMT)

PEG/PCL 两亲性三嵌段共聚物(PEG-b-PCL-b-PEG), 简称 PECL ,

PECL 制备 :在 100ML 四口烧瓶中加入 10 克 PCL ,加热溶解, 40°C 加入物质的量为 A 的两倍的物料 TDI (甲苯二异氰酸酯); 升温至 80°C 反应 3h,然后加入与剩余异氰酸基等物质的量或者稍过量的物料 C ,继续反应 3h 左右。粗产物溶于氯仿, 然后加入过量溶剂沉析, 离心分离或者减压抽滤得到 PECL 两亲性三嵌段共聚物。

PMT 制备 :采用自乳化法溶剂蒸发制备 PMT ,把紫杉醇和 PECL 溶于有机溶剂中, 在磁力搅拌下缓慢滴加到双蒸水中, 直到溶剂挥发完, 胶束内核固化成球, 离心分离, 冷冻干燥即得 PMT

四：常用紫杉醇助溶剂的选择

聚氧乙烯蓖麻油(Cremophor EL)和无水乙醇 (1:1) 常用于紫杉醇增溶剂。

五：紫杉醇细胞实验操作

Cell lines: 细胞, 包括人类新生儿皮肤微血管内皮细胞(HMVECs), 人脐静脉内皮细胞(HUVECs), 人脐动脉内皮细胞 (HUAVECs), 正常人类星形胶质细胞(NHAs), 正常人体皮肤成纤维细胞(NHDFs), 正常人表皮角质形成细胞(NHEKs), 人类乳腺上皮细胞(HMEpCs), 人前列腺上皮细胞(PrEpCs) 和人脐动脉平滑肌细胞 (UASMCs) ;

Concentrations: 0.1 pM-100 pM ; **Incubation Time:** 72 小时 ;

Method: 培养细胞, 包括人类新生儿皮肤微血管内皮细胞(HMVECs), 人脐静脉内皮细胞(HUVECs), 人脐动脉内皮细胞 (HUAVECs), 正常人类星形胶质细胞(NHAs), 正常人体皮肤成纤维细胞(NHDFs), 正常人表皮角质形成细胞(NHEKs), 人类乳腺上皮细胞(HMEpCs), 人前列腺上皮细胞(PrEpCs) 和人脐动脉平滑肌细胞 (UASMCs)。在 96 孔板中使用 6 和 12 通道的细胞进行增殖。细胞按每孔 3000-5000 个细胞接种, 然后粘附 4 小时。Paclitaxel 在培养基中稀释, 然后按一式四份加到孔中, 细胞温育 3 天, 然后加入 MTS 试剂, 然后定量测量每孔中的活细胞。

【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

J BIOMED NANOTECHNOL 2015	CARBOHYD POLYM 2015.10	COLLOID SURFACE B 2014	Biomaterials 2015
J BIOMED NANOTECHNOL 2016	J Drug Target. 2015;23(9)832-846	Oncotarget-2016	PHARM-DEV-TECHNOL 2016
ACS-APPL-MATER-INTER, 2017	J-Nanopart-Res, 2016	Chin-Med-J-(Engl), 2016, 129(20):2469-2475	Colloids-and-Surfaces-B, 2017

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。