

## 培美曲塞二钠 ; Pemetrexed Disodium

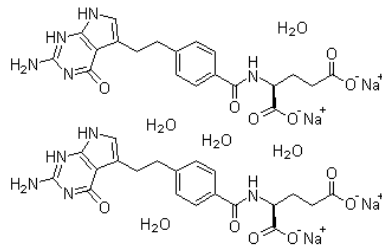
产品编号 : MB1183

质量标准 : >99%,BR,水合物

包装规格 : 200MG;1G;5G

产品形式 : 类白色或淡黄色粉末

### 基本信息

分子式	2(C <sub>20</sub> H <sub>19</sub> N <sub>5</sub> Na <sub>2</sub> O <sub>6</sub> ),5(H <sub>2</sub> O)	结构式	
分子量	1032.84		
CAS No.	357166-30-4		
储存条件	2-8°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	易溶于水 难溶于乙醇、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。		

**简介:** 培美曲塞二钠水合物 Pemetrexed disodium hemipenta hydrate 是一种叶酸拮抗剂 (antifolate)。抑制胸苷酸合成酶 (TS), 二氢叶酸还原酶 (DHFR) 和甘氨酸胺核苷酸甲酰转移酶 (GARFT),  $K_i$  分别为 1.3 nM, 7.2 nM 和 65 nM。

**别名:** Pemetrexed sodium hydrate ; 培美曲塞二钠水合物;

N-[4-[2-(2-amino-4,7-dihydro-4-oxo-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-yl)ethyl]benzoyl]-L-Glutamic acid,sodium salt,hydrate;Pemetrexed sodium hydrate (1:2:2.5)

### 物理性状及指标 :

外观 : .....类白色或淡黄色粉末

熔点 : .....254-258°C (lit.)(dec.)

溶解性 : .....易溶于水, 难溶于乙醇、氯仿和乙醚

含量 : .....>99%

**储存条件:** 2-8°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Pemetrexed Disodium Hydrate 是一种新型抗叶酸剂和抗代谢物质, 作用于 TS, DHFR 和 GARFT, $K_i$ 分别为 1.3 nM, 7.2 nM 和 65 nM。		
<b>靶点</b>	TS 1.3 nM(Ki)	DHFR 7.2 nM(Ki)	GARFT 65 nM(Ki)
<b>体外研究</b>	Pemetrexed disodium 在 CCRF-CEM 白血病, GC3/C1 结肠癌, 和 HCT-8 回盲部结肠癌细胞中表现出抗肿瘤活性, IC <sub>50</sub> 分别为 25 nM, 34 nM 和 220 nM。一项最近的研究表明 cisplatin 和 Pemetrexed 结合 SOCS-1 基因转移, 通过抑制细胞增殖和侵袭, 以及诱导感染腺病毒表达 SOCS-1 载体的 MPM 细胞凋亡, 表现出抗肿瘤作用。		
<b>体内研究</b>	在人 H460 非小细胞肺癌异种移植瘤中, Pemetrexed disodium 产生持续依赖性肿瘤生长延		

	迟(TGD)。
--	---------

**美仑相关产品推荐**

MB1183-S	培美曲塞二钠 (标准品)
MB2040	培美曲塞酸
MB2040-S	培美曲塞酸(标准品)
CL-10502	Pemetrexed

**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。培美曲塞是一种结构上含有核心为吡咯嘧啶基团的抗叶酸制剂，通过破坏细胞内叶酸依赖性的正常代谢过程，抑制细胞复制，从而抑制肿瘤的生长。本品可用于相关领域的科研实验。

**经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>酶测定和方法:</b></p> <p>TS 活性使用分光光度法测定, 监测由于产物 7,8-dihydrofolate 的形成, 导致的 340 nm 处吸光度增加。实验缓冲液包含 50 mM N-tris[羟甲基]甲基-2-氨基乙磺酸, 25 mM MgCl<sub>2</sub>, 6.5 mM 甲醛, 1 mM EDTA, 和 75 mM 2-巯基乙醇, pH 7.4。脱氧鸟苷酸单磷酸盐, 6R-MTHF, 和 hIS 的浓度分别为 100 μM, 30μM 和 30 nM (1.7 milliunits/mL)。在 6R-MTHF 浓度下, 测定未抑制的反应和 6 个浓度的抑制剂。K<sub>i app</sub> 值使用 ENZFITTER 程序通过非线性回归分析将数据拟合到 Morrison 方程测定。K<sub>i</sub> 值使用如下方程式计算: <math>K_{i app} = K_i(1 + [S]/K_m)</math>, 其中[S] 等于 30 μM, K<sub>m</sub> 等于 3 μM。DHFR 活性通过分光光度法在 340 nm 下监测底物 NADPH 和 7,8-二氢叶酸的消失测定。反应于 25°C 下在 0.5 mL 50 mM 磷酸钾缓冲液中进行 缓冲液包含 150 mM KC1 和 10 nM 2-巯基乙醇, pH 7.5, 和 14 nM (0.34 milliunit/mL) DHFR。NADPH 浓度为 10 μM, 而 7,8-二氢叶酸的浓度在 5, 10, 或 15 μM 间变化。在每个 7,8-二氢叶酸的浓度下, 未抑制的反应和 7 个抑制剂浓度被测定。使用 ENZFITTER 微机程序通过非线性回归分析将数据拟合到 Morrison 方程以得到 K<sub>i app</sub> 值。K<sub>i app</sub> = K<sub>i</sub>(1 + [S]/K<sub>m</sub>), 其中[S] 等于使用的 7,8-二氢叶酸的浓度, 而 7,8-二氢叶酸的 K<sub>m</sub> 等于 0.15 μM。GARFT 活性通过分光光度法在 295 nm 下监测产物 5,8-dideazafolate 形成导致吸光度的增加进行测定。反应溶剂包含 75 mM HEPES, 20% 甘油, 和 50 mM α-thioglycerol, pH 7.5, 温度为 25°C。底物和酶的浓度为 10 μM α,β-甘氨酸酰胺核苷酸, 0-10 μM 10-formyl-5,8-dideazafolic acid, 和 10 nM (1.9 milliunits/mL) GARFT。K<sub>i</sub> 值使用 Beckman DU640 分光光度计的酶作用机理程序计算, 其使用非线性回归分析将数据拟合到竞争性抑制的 Michaelis-Menten 方程。</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。