

拓扑替康盐酸盐 ; Topotecan HCl

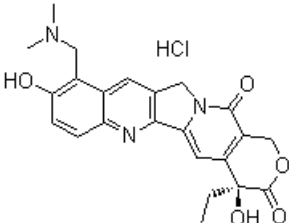
产品编号 : MB1253

质量标准 : >99.0%

包装规格 : 100MG;1G

产品形式 : 淡黄色至黄绿色粉末

基本信息

分子式	C23H23N3O5HCl	结构式	
分子量	458		
CAS No.	119413-54-6		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 91 mg/mL (198.72 mM) Water : 91 mg/mL (198.72 mM)		
	溶于甲醇，几乎不溶于乙醇 在稀释的无机酸溶液中溶解		
	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：.....淡黄色至黄绿色粉末

熔点：.....213-218 °C (dec.)

 溶解性：.....溶于甲醇、水(91 mg/ml , 25 °C) , DMSO (91 mg/ml , 25 °C) , 乙醇(<1 mg/ml at 25 °C)
在稀释的无机酸溶液中溶解.

含量：.....≥98%

IC50：.....HCT-8: IC50 = 1.5 nM (人); MCF7: IC50 = 1.8 nM (人);

.....DU-145 Luc cells: IC50 = 2 nM; A549: IC50 = 3.2 nM (人); SW-620: IC50 = 3.2 nM (人)

生物活性

产品描述	Topotecan HCl 是一种拓扑异构酶 I 抑制剂，作用于 MCF-7 Luc 细胞和 DU-145 Luc 细胞，无细胞试验中 IC50 分别为 13 nM 和 2 nM。		
特性	Topotecan 是 camptothecin 的水溶性衍生物。		
靶点	Topo I (DU-145 Luc cells) (Cell-free assay)	Topo I (MCF-7 Luc cells) (Cell-free assay)	
	2 nM	13 nM	
体外研究	Topotecan 对 DU-145 Luc 和 MCF-7 Luc 细胞具有很强的药物活性。DNA 复制期间 ,Topotecan 通过稳定拓扑异构酶 I 和 DNA 之间的共价复合物，并防止酶联单链 DNA 断裂后再连接，引起细		

	胞毒性。在耐辐射的人 B 系急性淋巴细胞性白血病(ALL)细胞中, Topotecan 稳定拓扑异构酶 I/DNA 可裂解复合物, 尽管 bcl-2 高度表达, 也能够引起快速的细胞凋亡, 并且剂量依赖性抑制 ALL 细胞的克隆生长。
体内研究	皮下接种 DU-145 Luc 细胞的动物肿瘤模型中, 通过尾钡和发光成像测定, Topotecan 处理导致肿瘤消退。未处理的对照组相关系数为 0.75, Topotecan 处理组为 0.93。同样, 对于未治疗的和 Topotecan 治疗的腹腔注射移植 MCF-7 Luc 细胞的小鼠, 肿瘤的发展与退化可使用发光成像检测。在严重联合免疫缺陷(SCID)的人预后不良 ALL 小鼠模型中, Topotecan 诱发有效的抗白血病活性。Topotecan 全身药物暴露时, 显著增加致命剂量人白血病细胞攻击的 SCID 小鼠的无病生存期。[2] 神经胶质瘤优先表达 TRAIL R2, 用 Topotecan 治疗显著上调其表达。

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。本品为抗肿瘤药, 是 S 期细胞周期特异性药物。本品显示了很强的抗肿瘤活性和广泛的抗癌谱, 临床前的体内抑瘤试验中对 P388 及 L1210 白血病、B16 黑色素瘤、B16/F10 黑色素瘤亚株、Lew'S 肺癌、ADJ-PC6 浆细胞瘤、M5076 卵巢肉瘤、乳腺癌 16/c、结肠腺癌 38 及 51、Wadison 肺癌等动物移植性肿瘤疗效显著。作用方式: 本品为拓扑异构酶 I 的抑制剂。拓扑异构酶 I 可诱导 DNA 单链可逆性断裂, 使 DNA 螺旋链松解, 本药可与拓扑异构酶 I -DNA 复合物结合并阻止这些单股断链的重新连接, 其细胞毒作用是在 DNA 的合成中, 是 S 期细胞周期特异性药物。本品与拓扑异构酶 I 和 DNA 形成的三元复合物与复制酶相互作用时产生双股 DNA 的损伤, 而哺乳动物的细胞不能有效地修复这些双股 DNA 链的中断。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1838 mL	10.9192 mL	21.8384 mL
5 mM	0.4368 mL	2.1838 mL	4.3677 mL
10 mM	0.2184 mL	1.0919 mL	2.1838 mL
50 mM	0.0437 mL	0.2184 mL	0.4368 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	Cell lines: MCF-7 Luc 和 DU-145 Luc 细胞 Concentrations: 0 µg/mL - 0.692 µg/mL Incubation Time: 96 小时 Method: Topotecan 溶解在无菌水中, 物料浓度为 1 mg/mL, 在培养基中稀释为 6 µg/mL, 然后在不透明的, 白色的, 组织培养物处理的微孔板中以 1:4 连续稀释至 0.1 mL/孔的终体积。MCF-7 Luc 和 DU-145 Luc 细胞以 3×10 ⁴ 细胞/mL 重悬浮在包含 10% FBS 和 0.5 mg/mL Geneticin 的高浓度葡萄糖 DMEM 中; 每孔中加入 100 µL 细胞。板在 37 °C, 95% 湿度/5% CO ₂ 环境中培养 4 天。培养后, 0.05 mL 包含 50 µg/mL D-荧光素的 0.1 M HEPES 缓冲液(pH 7.9)加入到每个孔中。室温下培养 10 分钟后, 培养微孔板在微孔板光度计和分子光成像仪上测量。微孔板光度计得到的结果使用不包含外源性药物的无抑制对照孔和包含 ATP 抑制剂的最大抑制对照孔进行计算。分子光成像法得到的结果使用 5 分钟发光成像得到的值类似计算。
动物实验	Animal Models: 负荷 MCF-7 Luc 或 DU-145 Luc 细胞的小鼠 Formulation: PBS

	Dosages: 0.25 mg/mL Administration: 腹腔注射给药
--	---

【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。