

## 氟尿嘧啶 ; 5-氟尿嘧啶 ; 5-氟尿嘧啶 ; 5-Fluorouracil

产品编号 : MB1273

质量标准 : >98%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C4H3FN2O2	结构式	
分子量	130.08		
CAS No.	51-21-8		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	H2O : 10 mg/mL (Need ultrasonic) DMSO : 15 mg/mL (115.31 mM; Need ultrasonic and warming)		
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 : .....白色或类白色结晶性粉末

熔点 : .....282-286 °C (lit.)(dec.)

溶解性 : .....H2O : 10 mg/mL (Need ultrasonic)  
DMSO : 15 mg/mL (115.31 mM; Need ultrasonic and warming)

密度 : .....1.54 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....98.0~102.0%

IC50 : .....COLO 320DM : IC50 = 1.1 μM (human); HeLa: IC50 = 1 μM (human);

.....L1210 : IC50 = 0.63 μM (mouse); HaCaT : IC50 = 0.4 μM (human);

.....PC-3: IC50 = 16 nM (human)

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - 230 mg/kg

### 生物活性

产品描述	Fluorouracil (5-Fluoracil, 5-FU)是 DNA/RNA 合成抑制剂,在肿瘤细胞中通过抑制胸苷酸合成酶 ( TS ) 而干扰核苷酸合成。
靶点	Thymidylate synthase (Tumor cells)
体外研究	Adrucil 是一种尿嘧啶类似物,在 C-5 位置上有一个氟原子。利用和尿嘧啶一致的转运途径快速进入细胞。Adrucil 在细胞内转化成几个活性代谢物: 氟脱氧尿苷单磷酸盐(FdUMP), 氟脱氧尿苷三磷酸盐(FdUTP) 以及氟尿苷三磷酸盐 (FUTP)。Adrucil 的代谢物 FdUMP 结合到 TS 核苷酸结合位点,与 CH2THF 形成稳定的三聚体,进而阻断了正常的底物 dUMP 的结合,抑制了 dTMP 的合成。Adrucil 代谢物能够插入 DNA,导致 DNA 双链断裂和细胞死亡。Adrucil

	的促凋亡作用可能和激活肿瘤抑制因子 P53 有关。P53 功能缺失降低细胞对 Adrucil 的敏感性。Adrucil 抑制存活诱导各种细胞的凋亡。Adrucil 抑制鼻咽癌细胞系 CNE2 和 HONE 的生存能力, Adrucil 抑制 Capan-1 细胞的生存能力, Adrucil 抑制 HT-29 细胞的生存能力, IC50 分别是 9 µg/mL, 3 µg/mL, 0.22 µM, 2.5 µM。
<b>体内研究</b>	Adrucil 在治疗包括结肠癌, 乳腺癌等各种癌症中有广泛应用。100 毫克/千克 Adrucil 显著抑制患有结肠癌小鼠的结肠 Colon 38 的生长, 肿瘤复制时间(TD), 生长延缓因子(GDF), 和 T/C 分别是 26.5 days, 4.4, 和 14%。

**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。本品在体内先转变为 5-氟-2-脱氧尿嘧啶核苷酸, 后者抑制胸腺嘧啶核苷酸合成酶, 阻断脱氧尿嘧啶核苷酸转变为脱氧胸腺嘧啶核苷酸, 从而抑制 DNA 的生物合成。此外, 通过阻止尿嘧啶和乳清酸掺入 RNA, 达到抑制 RNA 合成的作用。本品为细胞周期特异性药, 主要抑制 S 期细胞。

**储液配置**

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	7.6876 mL	38.4379 mL	76.8758 mL
5 mM	1.5375 mL	7.6876 mL	15.3752 mL
10 mM	0.7688 mL	3.8438 mL	7.6876 mL
50 mM	0.1538 mL	0.7688 mL	1.5375 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验:</b>	Cell lines: 人类结肠癌细胞系 HT-29 Concentrations: ~25 µM Incubation Time: 7 天 Method: 在 96 孔板中 Adrucil 处理细胞 7 天后测量生长抑制(4000 HT-29 细胞/孔, 在含 10%透析的牛胎儿血清 RPMI 1640 培养基中); 细胞附着过夜后加入增加浓度的 Adrucil。在培养结束时, 细胞用磷酸盐缓冲盐水(pH 7.4)清洗 3 次, 用 10%三氯乙酸在 4 °C 下固定 60 分钟。用去离子水洗 5 次, 加入 0.4% 碘酞罗丹明溶液在室温染色 15 分钟。未被碘酞罗丹明着色的通过 1%冰乙酸漂洗去除。然后, 着色的细胞蛋白质干燥, 溶解于 10 mM Tris-HCl。探测器在 540nm 波长处测定光密度值。
<b>动物实验:</b>	Animal Models: 38 小鼠结肠癌结肠 38 Formulation: PBS Dosages: 100 毫克/千克 Administration: 每周一次腹腔注射

**【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。