

唑来磷酸 ; Zoledronic acid hydrate

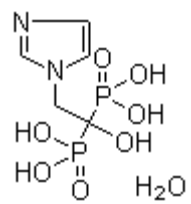
产品编号 : MB1329

质量标准 : >99%,一水化合物,BR

包装规格 : 100MG;1G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C ₅ H ₁₀ N ₂ O ₇ P ₂ .H ₂ O	结构式	
分子量	290.10		
CAS No.	165800-06-6		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性	H ₂ O : 5mg/ml (加热)		
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: 唑来磷酸一水合物 Zoledronic acid monohydrate 是第三代含氮二磷酸盐, 能够抑制破骨细胞介导的骨吸收, 同时具有抗肿瘤活性。

别名: Zoledronate monohydrate; CGP 42446 monohydrate; CGP42446A monohydrate; ZOL 446 monohydrate

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

熔点 :238.9 °C (dec.)

 溶解性 :H₂O : 5mg/ml (加热)

干燥失重 :5.0~8.0%

含量 :>99%

 IC₅₀ :FDPS: IC₅₀ = 3 nM (人); Osteoclastogenesis: IC₅₀ = 15 nM ;

法尼基焦磷酸合成酶 : IC₅₀ = 110 nM (杜氏利什曼虫) ;

aSMase: IC₅₀ = 5 μM ; 胎儿成骨细胞的增殖(hFOB): IC₅₀ = 40 μM (人)

生物活性

产品描述	Zoledronic acid, 一种含氮的二磷酸盐, 是有效的 破骨细胞 抑制剂, 可通过抑制甲戊二羟酸途径的酶、阻止小 GTP 结合蛋白如 Ras 和 Rho 的异戊二烯化来诱导破骨细胞凋亡。
体外研究	唑来磷酸通过增加 OPG 蛋白分泌和减少跨膜 RANKL 在人成骨细胞中的表达间接抑制破骨细胞成熟。用强效含氮的 BP, 唑来磷酸 (ZOL) 治疗原代人 OB 样细胞, 导致膜结合的 RANKL 蛋白表达下调。除了直接影响破骨细胞谱系的细胞, 唑来磷酸可以抑制骨吸收通过减少跨膜 RANKL 表达和增加 OPG 分泌破骨细胞 (OB) 样细胞。唑来磷酸诱导人胰腺癌细胞生长抑制 (IC ₅₀ : 10~50 μM) 和凋亡死亡。促凋亡作用与 Caspase-9 和聚 (ADP) 核糖聚合酶的裂解/激活有关, 而与 caspase-3 无关。它干扰了 p21ras 下游的生长和存活途径。唑来磷酸也是一种有效的血管生成抑制剂。在体外, 唑来磷酸抑制人胎牛血清、碱性成纤维细胞生长因子 (bFGF) 和血管内皮生长因子 (IC ₅₀ 值分别为 4.1、4.2 和 6.9 μM) 刺激的人血管内皮细胞的增殖, 并调节内皮细胞的粘附和迁移。在培养的主动脉环和鸡胚绒毛尿囊膜试验中, 唑来磷酸可减少血管发芽。ZOL 对 HUVEC 的粘附和迁移也有浓度依赖性、双相作用。ZOL 浓度为 1

	<p>μm 和 3μm 时, 细胞黏附增加, 在 30μm 和 100μm 处抑制, 细胞迁移受 0.3~10μm ZOL 刺激, 30μm 完全抑制细胞迁移。这些结果表明, ZOL 可干扰内皮细胞的细胞骨架功能。</p>
体内研究	<p>唑来磷酸可影响乳腺癌对内脏器官和骨骼的转移。当系统给药时, 唑来磷酸能有效地抑制皮下植入用 bFGF[ED50, 3μg/kg(7.5 nmol / kg)S.C]诱导的血管生成。在 GES 移植骨肉瘤(OS) 细胞中, ZOL 给药预防骨溶解, 并显著减少 OS 诱导骨形成的量, 同时对原发部位的肿瘤负荷没有影响。ZOL 未能减少肺转移, 并且在某些情况下与更大和更多的转移病灶相关。</p>

美仑相关产品推荐

MB1329-S	唑来磷酸 (标准品)
MB20949	唑来磷酸-15N2,13C2

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。唑来磷酸的主要药理作用是抑制骨吸收。其作用机制尚不完全清楚, 可能与多方面作用有关。唑来磷酸在体外可抑制破骨细胞活动, 诱导破骨细胞凋亡。还可以通过与骨的结合阻断破骨细胞对矿化骨和软骨的吸收。唑来磷酸还可抑制因肿瘤产生的多种刺激因子诱发的破骨细胞活性增加和骨钙的释放。

储液配置

体 积 浓度	质 量 1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.4471 mL	17.2354 mL	34.4709 mL
5 mM	0.6894 mL	3.4471 mL	6.8942 mL
10 mM	0.3447 mL	1.7235 mL	3.4471 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	
细胞实验	<p>细胞系: 人 PC 细胞系 (BXPC-3、CFPAC-1 和 PANC-1) 浓度: 1-100μm 培养时间: 72 小时 方法: BXPC-3 和 CFPAC-1 分别是在 RPMI 1640 和 ISCOVE 改良 DulbCo 培养基中生长的人胰腺癌细胞系。PANC-1 是在 DulbCo 改性 EAG 培养基 (DMEM) 中生长的人上皮样胰腺癌细胞系。培养基中添加 10%胎牛血清、2μmL 谷氨酰胺、100μg/ml 链霉素和 100μU/ml 青霉素。在 5%CO₂ (CO₂) 的加湿气氛中, 在 37°C 恒温下培养所有 PC 细胞系。将中和的 ZOL 钠盐溶解在无菌的 DDH₂O 中, 并在 1-100μm 的范围内使用终浓度。在 MTT 分析中, 在存在浓度增加的 ZOL 的情况下, 在 PC 细胞上进行细胞增殖分析。简单地, 将 PC 细胞 (3×10⁴ / 瓶) 接种于含有培养基的血清中的 96 孔板中, 并允许附着 24 小时。然后将培养基除去, 并用含有不同浓度的 ZOL 的新培养基替换。在这些条件下培养细胞, 时间跨度为 72 小时。然后在 37°C 下, 用 10μL 噻唑蓝 (MTT, 5 毫克 mg/ml) 1 的细胞孵育 1 小时, 孵育后, 在每个孔中加入 100μL 的异丙醇 0.04μN HCl, 测定吸光度。D 在微板读数器中的波长为 620 nm。</p>
动物实验	<p>Animal Models: Female mice (strain Tiflbm:MAG) Formulation: 5% mannitol solution Dosages: 1, 10 and 100 μg/kg Administration: s.c.</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。