

Cabazitaxel ; 卡巴他赛

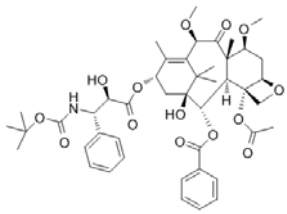
产品编号 : MB1403

质量标准 : ≥99%

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : 白色结晶性粉末

基本信息

| | | | |
|---------------|---|-------------|---|
| 分子式 | C45H57NO14 | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 835.93 | | |
| CAS No. | 183133-96-2 | | |
| 储存条件 | -20°C, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 2mg/mL Water : Insoluble 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。 | | |

简介: Cabazitaxel 是天然紫杉烷脱乙酰基巴卡丁 III 的半合成衍生物, 具有显著的抗肿瘤功效。

别名: XRP6258; RPR-116258A; taxoid XRP6258 ;

物理性状及指标 :

外观 :白色结晶性粉末

溶解性 :DMSO : 2mg/mL ; Water : Insoluble ; Ethanol Insoluble

纯度 :≥99%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | |
|-------------|--|
| 产品描述 | Cabazitaxel 是一种天然紫杉烷的半合成衍生物, 能够抑制细胞分裂和生长, 从而杀死癌细胞。抑制微管生长和聚合。 |
| 特性 | Cabazitaxel 是一种天然紫杉烷的半成品衍生物。 |
| 靶点 | Microtubule (Cell-free assay) |
| 体外研究 | Cabazitaxel 会增加大鼠肝细胞中 CYP3A 的酶活性。在体外人源血浆蛋白与 Cabazitaxel 平均结合率是 91.6%。Cabazitaxel 会被迅速广泛地代谢成多种代谢产物。Cabazitaxel 在多个鼠和人的抗性细胞系中都有活性。用相对较低浓度的 Cabazitaxel 处理四天会产生明显的细胞毒性。Cabazitaxel 在 3 种结肠癌细胞株(HCT-116, HCT-8 和 HT-29) 中都有很高的抗肿瘤活性。 |
| 体内研究 | 在其它相关模型中 Cabazitaxel 也有明显的抗肿瘤活性。在小鼠肿瘤异种移植模型 (结肠 C38 和 胰腺 P03)中 Cabazitaxel 具有完全的肿瘤抑制性。利用人恶性胶质瘤细胞 SF-295 和 U251 建立原位和皮下的小鼠异种移植模型。Cabazitaxel 对大部分皮下移植的肿瘤具有完全抑制性。此外, Cabazitaxel 在原位模型中对 40%的 U251 肿瘤具有抑制作用。 |

美仑相关产品推荐

| | |
|--------|------------------------------------|
| MB1383 | 安丝菌素 P-3 ; 束丝放线菌 ; ANSAMITOCIN P-3 |
| MB5742 | 埃博霉素 A |
| MB6175 | Maytansinol |
| MB1327 | Prednisone |
| MB1478 | 盐酸米托蒽醌 |
| MB1904 | 羟丙基β环糊精;2-羟丙基-β-环糊精 |
| MA0028 | 去离子无菌水(细胞培养用水) |

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。Cabazitaxel 的抗癌作用机制和特点与多西他赛相似，属于抗微管类药物。卡巴他赛通过与微管蛋白结合，促进其组装成微管，同时可阻止这些已组装好了的微管解体，使微管稳定，进而抑制细胞的有丝分裂，和间期细胞功能（interphasecellularfunctions）的发挥。

储液配置

| 体 积 浓度 | 质 量 | | |
|-----------|-----------|-----------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 1.1963 mL | 5.9814 mL | 11.9627 mL |
| 5 mM | 0.2393 mL | 1.1963 mL | 2.3925 mL |
| 10 mM | 0.1196 mL | 0.5981 mL | 1.1963 mL |
| 50 mM | 0.0239 mL | 0.1196 mL | 0.2393 mL |

经典实验操作（仅供参考）

一：Prednisone plus cabazitaxel or mitoxantrone for metastatic castration-resistant prostate cancer progressing after docetaxel treatment: a randomised open-label trial

Materials :Prednisone MB1327; cabazitaxel MB1403; mitoxantrone MB1478

Methods We undertook an open-label randomised phase 3 trial in men with metastatic castration-resistant prostate cancer who had received previous hormone therapy, but whose disease had progressed during or after treatment with a docetaxel-containing regimen. Participants were treated with 10 mg oral prednisone daily, and were randomly assigned to receive either 12 mg/m² mitoxantrone intravenously over 15–30 min or 25 mg/m² cabazitaxel intravenously over 1 h every 3 weeks. The random allocation schedule was computer-generated; patients and treating physicians were not masked to treatment allocation, but the study team was masked to the data analysis. The primary endpoint was overall survival. Secondary endpoints included progression-free survival and safety. Analysis was by intention to treat. This study is registered at ClinicalTrials.gov, NCT00417079

二：卡巴他赛增溶剂的选择，稳定溶液可用于体内实验

1 材料 卡巴他赛 4g，HPCD(美仑货号 MB1904) 0.8 克，冰醋酸适量，活性炭 0.1 克，无菌纯水 100ml(美仑货号 MA0028)。

2 工作液配置方法。取无菌纯水，降温至 30-40℃，加入卡巴他赛搅拌使完全溶解，加入 HPCD 搅拌均匀，加入 0.1%(g.ml) 活性炭，室温搅拌，吸附 15min, 过滤脱碳。补充无菌水至全量，并冰醋酸调 pH 为 3.5-5.0。灌装，121℃湿热灭菌。

部分客户使用美仑产品发表文献举例

Isostructurality Among Solvates of Cabazitaxel: X-ray Structures and New Solvates Preparation ; DOI:

10.1002/jps.24374 Journal of Pharmaceutical Sciences.

【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。