

Fludarabine ; 氟达拉滨

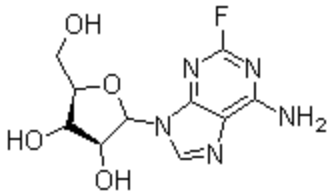
产品编号：MB1723

质量标准：≥99.0%,BR

包装规格：200MG;1G

产品形式：白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C10H12FN5O4	结构式	
分子量	285.23		
CAS No.	21679-14-1		
储存条件	2-8℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 57 mg/mL (199.83 mM) 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：氟达拉滨 Fludarabine(NSC 118218)是 DNA 合成抑制剂。

别名：F-ara-A; NSC 118218 ; 9H-Purin-6-amine, 9-β-D-arabinofuranosyl-2-fluoro

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色结晶性粉末

熔点：.....252.0~258.0℃

溶解性：.....溶于(<1 mg/mL , 25 °C), DMSO (57 mg/mL , 25 °C),和乙醇(<1 mg/mL , 25 °C)。

密度：.....2.18 g/cm³ (预测)

干燥失重：.....≤3.0%

IC50：.....CCRF-CEM: IC50 = 400 nM (人); 抗增殖活性：IC50 = 1.54 μM (RPMI 细胞);

.....L1210: IC50 = 3 μM (小鼠); HEp-2: IC50 = 9 μM (人); K562: IC50 = 0.6 ug.mL⁻¹ (人)

储存条件：2-8℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Fludarabine 在血管平滑肌细胞中是一种 STAT1 活化 抑制剂,特异性降低 STAT1 蛋白质水平 (和 mRNA 水平) ,而对其他 STATs 无此作用。它还是一种 DNA 合成 抑制剂。
靶点	STAT1 (Vascular smooth muscle cells)
体外研究	Fludarabine 有效抑制 RPMI8226 细胞增殖,呈时间浓度依赖性。Fludarabine 处理 MM.1S 和 MM.1R 细胞 48 小时的 IC50 分别为 13.48μg/mL 和 33.79μg/mL。而 Fludarabine 处理 U266 细胞 48 小时的 IC 50 为 222.2μg/mL。Fludarabine 处理可增加处于细胞周期 G 1 期的细胞数量,并伴随着处于细胞周期 S 期细胞数量的减少,对细胞周期的影响呈时间依赖性。Fludarabine 在 MM 细胞中诱导细胞周期阻滞和细胞凋亡。Fludarabine 时间依赖性的诱导 caspase , -8, - 9 和 - 3, - 7 的剪切,继而诱导 PARP 的剪切 。氟达拉滨以时间梯度增加 Bax 基因表达,而 Bak 基因表达量不变。RPMI 8226 细胞用 Fludarabine 处理 12 小时,处

	<p>理后细胞膜电位降低，61.05%的细胞表达低荧光罗丹明 123，而未处理的对照组细胞仅为 8.62%。为提高溶解度，Fludarabine 可制为一磷酸盐形式(F-ara-AMP, fludarabine)，在静脉滴注后即可即时、定量的从母核上去磷酸化。细胞内重磷酸化修饰导致 Fludarabine-阿糖胞苷三磷酸 (F-ara-ATP)。该代谢产物抑制了 DNA 复制的几个关键过程，如 DNA 合成所需酶，比如核糖核酸还原酶，DNA 引发酶，DNA 聚合酶，具有 3' - 5' 外切酶活性的脱氧核糖核酸聚合酶 δ 和 ϵ 和 DNA 连接酶。通过检测 ICAM - 1 的表达和 IL - 8 释放，表明 Fludarabine 还可以诱导前炎症刺激单核细胞的增加。Fludarabine 对卵巢癌细胞系生长无影响，而它对黑色素瘤细胞系有明显的剂量依赖性抑制。Fludarabine 诱导显著降低 STAT - 1 磷酸化，但不改变 JAK 2 活性。磷酸 Fludarabine 对三种 STAT 蛋白磷酸化影响不显著。Fludarabine (1.5mg) 在处理 2 天后和 7 天后显著降低磷酸化 STAT - 1 和 STAT-1 总蛋白量。磷酸化 JAK 2 在处理第 2 天变化不明显，处理后第 7 天的 JAK 表达明显受抑制。Fludarabine 不影响其他 STAT 蛋白质，特异性抑制 STAT - 1 激活以降低血管平滑肌细胞体外增殖。</p>
体内研究	<p>PBS 对照组中肿瘤细胞增长迅速，25 天内扩增为 10 倍。而用 40mg/kg Fludarabine 处理的肿瘤扩增不超过 5 倍。40mg/kg Fludarabine 对 RPMI 8226 细胞有明显的抗肿瘤效果。RPMI 8226 处理肿瘤细胞十天增加凋亡细胞核数量。Fludarabine 可在免疫缺陷小鼠中有效抑制 RPMI 8226 细胞的骨髓转移。</p>

美仑相关产品推荐

MB1723-S	氟达拉滨(标准品)
MB25564	氟达拉滨-13C,15N2
MB1285	氟达拉滨磷酸酯

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。氟达拉滨在体内经过代谢转变为活性成分，它可抑制核糖核苷酸还原酶、DNA 聚合酶、DNA 引物酶、DNA 连接酶，从而抑制 DNA 合成。本品对淋巴细胞有选择性毒性作用。

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.5059 mL	17.5297 mL	35.0594 mL
5 mM	0.7012 mL	3.5059 mL	7.0119 mL
10 mM	0.3506 mL	1.7530 mL	3.5059 mL
50 mM	0.0701 mL	0.3506 mL	0.7012 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: 地塞米松敏感(MM.1S) 和耐受 (MM.1R) 的人 MM 细胞系, RPMI8226 和 U266 细胞系</p> <p>Concentrations: 2 μg/ml</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method:</p> <p>对地塞米松敏感(MM.1S) 和耐受 (MM.1R) 的人 MM 细胞系, RPMI8226 和 U266 细胞系以 5×10^5 细胞密度铺板，实验组均包括氟达拉滨处理和空白对照组。处理后细胞用 PBS 清洗两次然</p>
-------------	--

	后用 70%冰乙醇固定，离心后用含 100 μ g/mL 核糖核酸酶 PBS 重悬浮，37 $^{\circ}$ C 孵育 30 分钟。样品重悬于 25 μ g/mL 碘化吡啶中，用流式细胞仪检测。根据产品说明用 Annexin V-FITC 试剂盒检测细胞凋亡。利用 TUNEL（末端脱氧核苷酸转移酶介导脱氧核苷酸缺口末端标记）法和原位细胞凋亡检测试剂盒处理细胞，最后用流式细胞仪分析。
动物实验	Animal Models: 携带 RPMI 8226 肿瘤细胞的免疫缺陷型小鼠 Formulation: PBS Dosages: 40 mg/kg Administration: 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。