

Rubitecan ; 鲁比替康 ; 9-硝基喜树碱

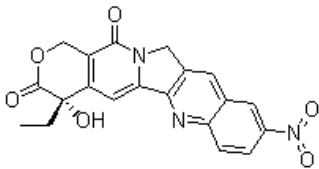
产品编号：MB1966

质量标准：>99%

包装规格：50MG;200MG

产品形式：黄色粉末

基本信息

分子式	C20H15N3O6	结构式	
分子量	393.35		
CAS No.	91421-42-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性	溶于 DMSO，氯仿和甲醇		
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：鲁比替康 (rubitecan,9-NC) 是一个半合成喜树碱衍生物，拓扑异构酶抑制剂，对实体瘤具有广泛的抑瘤活性，且对血液肿瘤已有显著疗效，可口服、毒性颇低，被誉为第二代 TOPO1 抑制药。欧美科学家正在对卢比替康进行乳腺癌、子宫颈癌、结肠直肠癌、头颈部肿瘤、肝癌、肺癌、脑癌、卵巢癌、慢性髓性白血病等的 II 期临床试验。本品仅限科研用途，严禁用于人体

别名：9-nitrocamptothecin ; Rubitecan ; 鲁比替康 ; 9-硝基喜树碱 ; 卢比替康

物理性状及指标：

外观：.....黄色粉末

溶解性：.....溶于 DMSO，氯仿和甲醇

密度：.....1.63 g/cm³

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....>99%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

药理作用

体外实验发现 9-NC 具有抗肿瘤作用，实验发现，不同浓度的 9-NC 及其代谢产物 9-AC 均可抑制人黑色素细胞 (MEL 细胞) 和人黑色素瘤细胞 (BRO 细胞) 在体外的生长。这种生长抑制伴随有 BRO 细胞的体积变大而后死亡，但 MEL 细胞并未发生这种变化。对于 MEL 细胞，9-NC 使其细胞周期停滞在 S 期与 G2 期的交界处，不引起或仅引起少数细胞的凋亡。HU 等检测 9-NC 对卵巢癌的一个细胞亚群 SKOV-3 的促凋亡作用，结果显示，9-NC 可部分而不是全部激活 SKOV-3 细胞的凋亡。提示 SKOV-3 细胞对 9-NC 的敏感性存在差异。此外，9-NC 除以上所述的抗肿瘤作用外，还有文献报道其放射增强作用和抗 HIV 病毒作用。

抗肿瘤的作用机制

9-NC 是通过抑制细胞存活中一种必需 TOPO1 来实现其细胞毒作用的。人 TOPO1 为单体酶，其主要功能是松弛 DNA 超螺旋，在 DNA 的复制、转录、重组中起重要作用。9-NC 以 TOPO1 为作用靶点，但其并非是通过抑制 TOPO1 的催化活性而杀死癌细胞的，而是通过与 TOPO1-DNA 断裂复合物可逆结合，形成药物-TOPO1-DNA 三元复合物，从而稳定了可裂解复合物，形成路障，使复制叉不能进行下去，从而导致细胞的

死亡。有研究表明，多种肿瘤细胞，特别是结肠癌、宫颈癌、卵巢癌等细胞内的 TOPO1 含量大大高于正常组织，尤其在 S 期肿瘤细胞中活性大幅度提高。这可能是 9-NC 杀伤选择性较好的原因之一。

另外，有研究表明，短期暴露于 9-NC 对 RNA 和 DNA 的损伤是可逆的，但随着浓度的增加和暴露时间的延长，对 DNA 的抑制进展为非可逆性，表现为剂量和实践的双向性。

耐药性研究

药物抵抗是所有化疗药物共同面对的一个难题。9-NC 口服给药时经常出现口服生物利用度较低、药动学和药物反应差异较大，甚至化疗失败等问题。就此，有人在细胞和人体水平进行实验，研究一些特异基因、转体蛋白和突变位点与这种现象的关系。研究发现，持续给与组织细胞型淋巴瘤细胞(U-937 细胞)9-NC 的耐药。由 CPT 介导的 NF-kappaB 激活相关。

药物转运体在大量临床药物的吸收、分布和清除过程中起着重要的作用，与肿瘤的多药耐药有关。多药耐药现象的形成是肿瘤化疗失败的重要原因。

美仑相关产品推荐

MB1253	拓扑替康盐酸盐
MB1124	伊立替康
MB1126	盐酸伊立替康,(CPT-11)
MB20655	拓扑替康-d6 羧酸钠盐

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。拓扑异构酶抑制剂。Rubitecan 可以诱导蛋白质连接的 DNA 单链断裂，阻断细胞分裂过程中的 DNA 和 RNA 合成。这种作用方式使 rubitecan 成为一种潜在的化疗药物，并已成功用于治疗难治性胰腺癌

【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(M ²)	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。