

培美曲塞酸 ; Pemetrexed

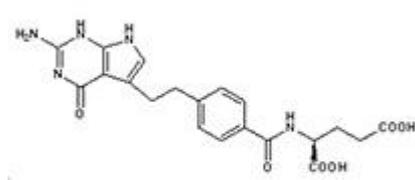
产品编号 : MB2040

质量标准 : >98%

包装规格 : 1 G ; 5 G ; 25G ;

产品形式 : 类白色或蓝灰色粉末

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₂₁ N ₅ O ₆	结 构 式	
分子量	427.41		
CAS No.	137281-23-3		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	溶于 DMSO 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 : 培美曲塞 Pemetrexed 是一种叶酸拮抗剂 (antifolate)。抑制胸苷酸合成酶 (TS), 二氢叶酸还原酶 (DHFR) 和甘氨酸酰胺核苷酸甲酰转移酶 (GARFT), K_i 分别为 1.3 nM, 7.2 nM 和 65 nM。

别名 : LY231514; Alimta; LY 231514; LY-231514; 培美曲塞酸; LY231514; Alimta; LY 231514; LY-231514

物理性状及指标 :

外观 :类白色或蓝灰色粉末

溶解性 :溶于 DMSO 和甲醇

含量 :>98%

储存条件 : 2-8°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Pemetrexed 是一种叶酸拮抗剂 (antifolate)。抑制胸苷酸合成酶 (TS), 二氢叶酸还原酶 (DHFR) 和甘氨酸酰胺核苷酸甲酰转移酶 (GARFT), K_i 分别为 1.3 nM, 7.2 nM 和 65 nM。
靶点	K_i : 1.3 nM (TS), 7.2 nM (DHFR), 65 nM (GARFT)
体外研究	培美曲塞 (LY231514) 二钠是一种新型经典抗叶酸剂, 其抗肿瘤活性可能是由于其多聚谷氨酸化代谢物同时和多重抑制几种关键的需要叶酸的酶所致。培美曲塞 (LY231514) 是已知的酶 FPGS ($K_m = 1.6\mu\text{M}$ 和 $V_{max} / K_m = 621$) 的最佳底物之一。多糖化和 LY231514 的多谷氨酸化代谢物可能在确定该新药的选择性和抗肿瘤活性方面发挥重要作用。尽管 LY231514 仅适度抑制 TS ($K_i = 340\text{nM}$, 重组小鼠), 但 LY231514 的戊谷氨酸的效力是 100 倍 ($K_i = 3.4\text{nM}$), 使得 LY231514 成为最有效的基于叶酸的 TS 抑制剂之一。
体内研究	用 PC61 加培美曲塞治疗的小鼠组比其他组的统计生存期更长。在生存分析中, PC61 加培美曲塞治疗组小鼠的存活率明显优于单独 PC61 组、大鼠 IgG 加培美曲塞治疗组或未治疗组。

美仑相关产品推荐

MB2040-S	培美曲塞酸(标准品)
MB1183	培美曲塞二钠
MB1183-S	培美曲塞二钠 (标准品)
CL-10502	Pemetrexed

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。培美曲塞是以吡咯嘧啶为基础的多靶向抗叶酸制剂，通过破坏细胞内叶酸依赖性的正常代谢过程，抑制细胞复制，从而抑制肿瘤的生长。具有广泛的体内抗肿瘤活性。培美曲塞最初被鉴定为是叶酸多聚谷氨酸合成酶的高效底物，它强烈地抑制嘌呤和嘧啶合成中多种叶酸依赖的酶，包括胸苷酸合成酶、二氢叶酸还原酶、甘氨酸亚胺核苷。核苷酸甲酰基转移酶和氨基咪唑羧酰胺核糖基甲酰基转移酶。其抗增殖活性已在多种实体瘤中得到证实，包括非小细胞肺癌、乳腺、间皮瘤、结直肠、胰腺、胃、膀胱、宫颈和头颈部。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3397 mL	11.6984 mL	23.3967 mL
5 mM	0.4679 mL	2.3397 mL	4.6793 mL
10 mM	0.2340 mL	1.1698 mL	2.3397 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	在室温下，通过监测[6S]-5, 6, 7, 8-四氢叶酸在 10-甲酰基-[6R, S]-5, 6, 7, 8-四氢叶酸中 A298 的形成，进行 AICARFT 抑制试验。所有溶液在使用前用 N ₂ 气体净化。反应溶液含有 33mM Tris-Cl、pH 7.4、25mM KCl、5mM 2-巯基乙醇、0.05mM AICA 核苷酸和 16nM AICARFT。使用 0.037、0.074 和 0.145mM 的 10-甲酰基-[6R,S]-5,6,7,8-四氢叶酸浓度(分别为其 K _m 值的 0.61、1.23 和 2.45 倍)。LY23 1514 在 0.08~0.8mM (四浓度) 下作为抑制剂进行测试。当 LY231514 的三和五戊二酸酯用作抑制剂时，其浓度为 0.0005-0.009mM(8 个浓度)。酶分析是通过添加酶引发的。使用 ZeFiver 程序分析竞争抑制的数据。
细胞实验	产生剂量响应曲线以确定 50%抑制生长所需的浓度 (IC ₅₀)。培美曲塞最初以 4mg/mL 的浓度溶解在 DMSO 中，然后用细胞培养基进一步稀释到所需的浓度。将 CCRF-CEM 白血病细胞在完全培养基中以 4.8×10 ⁴ 个细胞/孔的终浓度加入 24 孔丛集板中，总体积为 2mL，将不同浓度的试验化合物加入到复孔中，使 DMSO 的最终体积为 0.5%。在空气中的 CO ₂ 浓度为 5% 的空气中，在 37°C 下培养 72 小时。在孵育结束时，在 ZB-Culter 计数器上测定细胞数。在培养结束时，对照威尔斯通常含有 4×10 ⁵ ×6×10 ⁵ 个细胞。对于若干研究，在 300 μM AICA、5 μM 胸苷、100 μM 次黄嘌呤或 5 μM 次黄嘌呤和 100 μM 次黄嘌呤的组合存在下，测定每个化合物的 IC ₅₀ s。
动物实验	小鼠 使用 6-8 周龄雌性 CBA 小鼠和雌性 NOD/SCID 小鼠 (NOD CB17 PRKDCSCID)。普瑞美曲塞(100mg/kg)从第 4-8 天(连续 5 天)开始给予荷瘤小鼠腹腔注射，以探讨联合抗 CD25 抗体或 IgG 控制时的协同作用。目前研究中使用培美曲塞的剂量和时间是根据先前对小鼠的研究确定的。

【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 产品分类：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，这种产品需要放置于干燥器中保存。