

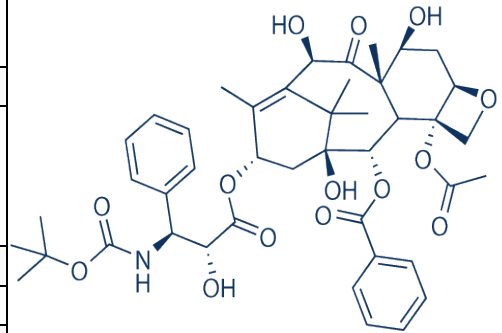
Docetaxel (Microtubule Associated抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0155-10mM	Docetaxel (Microtubule Associated抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0155-5mg	Docetaxel (Microtubule Associated抑制剂)	5mg
SC0155-25mg	Docetaxel (Microtubule Associated抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	Benzenepropanoic acid,β-[[[(1,1-dimethylethoxy)carbonyl]amino]-α-hydroxy-,(2aR,4S,4aS,6R,9S,11S,12S,12aR,12bS)-12b-(acetyloxy)-12-(benzoyloxy)-2a,3,4,4a,5,6,9,10,11,12,12a,12b-dodecahydro-4,6,11-trihydroxy-4a,8,13,13-tetramethyl-5-oxo-7,11-methano-1H-cyclodeca[3,4]benz[1,2-b]oxet-9-yl ester,(αR,βS)-
简称	Docetaxel
别名	Docetaxol, Docetaxel anhydrous, Docetaxel hydrate, Docetaxel trihydrate, NSC 628503, NSC-628503, NSC628503, RP 56976, RP-56976, Taxoltere metro, Taxotere
中文名	多西他赛
化学式	C ₄₃ H ₅₃ NO ₁₄
分子量	807.88
CAS号	114977-28-5
纯度	99.8%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 53mg/ml warmed
溶液配制	5mg加入0.62ml DMSO, 或每8.08mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0155-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Docetaxel, 一种taxol类似物, 是一种microtubules解聚抑制剂, 通过结合于稳定的微管发挥作用。			
信号通路	Cytoskeletal Signaling			
靶点	Microtubules	—	—	—
IC50	—	—	—	—
体外研究	Docetaxel是一种细胞毒性剂, 尤其对于增殖细胞, Docetaxel促进微管蛋白束的形成, 还能诱导持续的有丝分裂阻滞, 随后分裂阻滞的细胞凋亡或永久抑制分裂。Docetaxel抑制微管的动态不稳定性及踏车现象, 导致染色体不能分开到子细胞中, 这样又会反过来触发有丝分裂过早结束, 而不是在细胞周期的特定时期进行抑制作用。Docetaxel(150ng/ml)处理人类小细胞肺癌N417细胞系1小时, 抑制50%细胞生长。Docetaxel处理KB人类表皮癌细胞、T24人类膀胱癌细胞、Calc18人类乳腺癌细胞和HCT116人类结肠腺癌96-120小时, IC50值分别为8ng/ml、4ng/ml、5ng/ml和7ng/ml。Docetaxel处理人类癌细胞Hs746T(胃)、AGS(胃)、HeLa(子宫颈)、CaSki(子宫颈)、BxPC3(胰腺)、Capan-1(胰腺)24小时, 抑制克隆存活, IC50分别为1nM、1nM、0.3nM、0.3nM、0.3nM、0.3nM。通过克隆形成实验测评Docetaxel处理人类卵巢癌细胞系OVCA432、A2780、A2780/cp8 12天期间, IC50值分别达到0.06nM、0.6nM和3nM。Docetaxel作用于9种培养的人类胃癌细胞系(MKN-7、-28、-45、NUGC-4、KATO-III、ST-SA-1、NAKAJIMA、ST-KM、KKLS)时, IC50分别为>1.2μM、0.6nM、0.1nM、3.5nM、4nM、99nM、0.3nM、0.5nM、0.9nM。在体外, Docetaxel在极低浓度时, 抑制内皮细胞迁移, 这并不影响微管的大体形态或抑制细胞增殖, 对微管动力学产生更微妙的影响。Docetaxel抑制HUVEC迁移, IC50为1pM。Docetaxel抑制血管生成因子胸苷磷酸化酶或血管内皮生长因子刺激的			

	HUVEC趋化性, IC50为10pM。Docetaxel(30μM)在添加10%人血清的培养基中温育12小时, 诱导人单核细胞。
体内研究	Docetaxel(33mg/kg/dose, 静脉注射, 每四天注射3次)处理M2OL2结肠移植瘤, 结果肿瘤生长延迟19.3。Docetaxel作用于MX-1、SK-MEL-2、LX-1和OVCAR-3移植瘤, 也具有很强的抗肿瘤活性。Docetaxel抑制成纤维细胞生长因子2的血管反应, IC50为5.4mg/kg, Docetaxel按10mg/kg剂量处理小鼠, 在14天期间, 每周注射两次, 结果血管完全堵塞。Docetaxel对内皮细胞迁移和/或微血管形成具有选择性, 因为炎症细胞浸润到基底膜对Docetaxel抑制不太敏感。
临床实验	N/A
特征	N/A

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	人类胃癌细胞系MKN-28
浓度	6nM
处理时间	3天
方法	180μl培养基中的2000个细胞接种到96孔板中, 20μl药物溶液同时按一式三份加到每孔中。实验板在37°C下含5% CO2的培养箱中温育3天。在第3天, 每孔加入25μl MTT试剂。温育4小时后, 除去培养基。每孔加入0.2ml DMSO, 使用机械式搅拌机充分混合, 溶解形成的MTT-甲臜晶体。在540nm(OD)处测定吸光值。

动物实验	
动物模型	携带人类结肠癌移植瘤CX-1的小鼠
配制	50mg/ml储存液溶于乙醇, 加入同等体积的聚山梨酯80, 然后使用溶于水的5%葡萄糖稀释到最终体积。
剂量	33mg/kg
给药方式	静脉注射, 每四天注射3次

参考文献:

1. Riou JF, et al. Biochem Biophys Res Commun. 1992; 187(1):164-170.
2. Silvestrini R, et al. Stem Cells. 1993; 11(6):528-35.
3. Dykes DJ, et al. Invest New Drugs. 1995; 13(1):1-11.
4. Tanaka M, et al. Eur J Cancer. 1996; 32A(2):226-330.
5. Moos PJ, et al. J Immunol. 1999; 162(1):467-473.
6. Hotchkiss KA, et al. Mol Cancer Ther. 2002; 1(13):1191-1200.
7. Buey RM. Chem Biol. 2004; 11(2):225-236.
8. Balcer-Kubiczek EK, et al. Chemotherapy. 2006; 52(5):231-240.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0155-10mM	Docetaxel (Microtubule Assosiated抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0155-5mg	Docetaxel (Microtubule Assosiated抑制剂)	5mg
SC0155-25mg	Docetaxel (Microtubule Assosiated抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C避光保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温避光保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C避光保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。

2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制成高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09