

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	T70014
产品名称:	替莫唑胺

产品简介:

一种可透过血脑屏障的口服活性的 DNA 烷基化 (DNA alkylating) 剂。Temozolomide 也是一种促自噬 和促凋亡 剂。Temozolomide 对以低水平的 O6-烷基鸟嘌呤 DNA 烷基转移酶 (OGAT) 和功能失配修复系统为特征的肿瘤细胞有效。Temozolomide 具有抗肿瘤和抗血管生成作用。

靶点: DNA alkylator

体外研究:

Temozolomide (TzM) 是一种甲基化剂,可穿过血脑屏障,适用于恶性神经胶质瘤和转移性黑色素瘤。Temozolomide 可有效对抗以低水平 O6-烷基鸟嘌呤 DNA 烷基转移酶 (OGAT) 和功能错配修复系统 (MR) 为特征的肿瘤细胞。测定 Temozolomide (TzM) 在不同细胞系中的 IC50 值范围为 14.1 至 234.6 μ M,分为两个明显不同的组:低 IC50 的细胞系值 (<50 μ M),包括 A172 (14.1 $\pm$ 1.1 μ M) 和 LN229 细胞 (14.5 $\pm$ 1.1 μ M),以及具有高 IC50 值 (>100 μ M) 的那些,包括 SF268 (147.2 $\pm$ 2.1 μ M) 和 SK-N-SH 细胞 (234.6 $\pm$ 2.3 μ M)。

体内研究:

与对照相比, Temozolomide (TzM) 作为单一药物不会显著增加中值生存时间 (MST)。值得注意的是,在施用 100 或 200 mg/kg Temozolomide 之前,颅内注射 NU1025 可显著延长对照组或仅接受 Temozolomide 处理组的生命。分割 Temozolomide 时,使用该方案获得的寿命延长 (ILS) 高于 NU1025 联合单次注射 Temozolomide 时观察到的 (生存曲线统计比较: NU1025 颅内注射 + Temozolomide 100 mg/kg $\times$ 2 vs NU1025 + Temozolomide 200 mg/kg; P=0.023)。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 20.83 mg/mL (107.29 mM; 超声助溶)			
Water: 2.86 mg/mL (14.73 mM; 超声助溶)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	5.1507 mL	25.7533 mL	51.5066 mL
5 mM	1.0301 mL	5.1507 mL	10.3013 mL
10 mM	0.5151 mL	2.5753 mL	5.1507 mL
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (protect from light, stored under nitrogen).			
注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline			
Solubility: $\geq$ 1.25 mg/mL (6.44 mM); 澄清溶液			
此方案可获得 $\geq$ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。			
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。			



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (6.44 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。

2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (6.44 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： PBS

Solubility: 5 mg/mL (25.75 mM); 澄清溶液; 超声助溶

注: 工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

三、细胞实验

细胞系: L-1210 和 L-1210/BCNU 细胞

浓度: 0 μ M -100 μ M

处理时间: 1 小时

方法: L-1210 和 L-1210/BCNU 细胞以 0.2×10^4 cells/mL 接种, 并培养 24 小时。培养基用 Methazolastone 在 37°C 下处理 1 小时, 然后用 PBS 洗涤两次, 离心并重新悬浮在新鲜培养基中。对照组和处理试样在 48 小时以 1:4 在新鲜培养基中稀释, 第 96 小时, 以 1:2 稀释。整个实验中使用这些稀释的细胞浓度介于 3×10^5 和 8×10^5 /mL 之间。该范围内对照组呈对数生长。

四、动物实验

动物模型: 负荷 L-1210 和 L-1210/BCNU 细胞的 DBA/2 小鼠

剂量: 40 mg/kg

给药处理: 静脉注射给药

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: 2-8°C

