

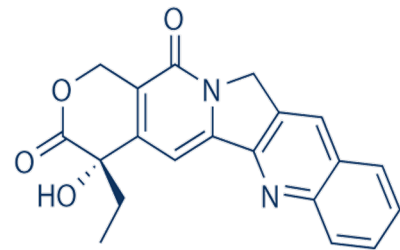
## Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0141-10mM	Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0141-5mg	Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)	5mg
SC0141-25mg	Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(4S)-4-ethyl-4-hydroxy-1H-pyrano[3',4':6,7]indolizino[1,2-b]quinoline-3,14(4H,12H)-dione
简称	Camptothecin
别名	Camptothecine, (S)-(+)-Camptothecin, (+)-Camptothecine, (+)-Camptothecin, CPT
中文名	喜树碱
化学式	C <sub>20</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
分子量	348.35
CAS号	7689-03-4
纯度	99.7%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 5mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.44ml DMSO, 或每3.48mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0141-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Camptothecin是一种特异性的DNA topoisomerase I(Topo I)抑制剂, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为0.68μM。Phase 2。				
信号通路	DNA Damage				
靶点	Topo I	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	0.68μM	—	—	—	—
体外研究	Camptothecin是1966年最先从Camptotheca acuminata独立的植物碱。有效且特定抑制DNA拓扑异构酶I(topo I), IC <sub>50</sub> 为0.68μM。Camptothecin在纳摩尔水平作用于多种人类肿瘤细胞系, 包括HT29、LOX、SKOV3和SKVLB, 有一定细胞毒性, IC <sub>50</sub> 为37nM到48nM。与TNF联用, Camptothecin作用于鼠肝细胞, 诱导凋亡, IC <sub>50</sub> 为13μM。Camptothecin也废除TNF诱导的NF-κB激活、和TNF受体相关因子-2(TRAF2)、X-连锁凋亡蛋白抑制剂(X-IAP)和FLICE抑制蛋白(FLIP)的表达。5μM Camptothecin作用于HCT116细胞, 诱导蛋白酶体调节的混合系白血病5(MLL5)蛋白降解, 导致p53在Ser392位点磷酸化。由于Camptothecin的溶解性低及具有一定副作用, 所以已经研发了多种Camptothecin类似物, 其中两种如Topotecan和Irinotecan, 已经获得FDA核准, 用于癌症化学疗法中。				
体内研究	Camptothecin按8mg/kg剂量作用于携带多种移植瘤的小鼠, 如结肠癌、肺癌、乳腺癌、胃癌和卵巢癌, 完全抑制肿瘤生长及引起肿瘤衰退。Camptothecin(50mg/kg)和TNF(5和7μg/kg)联合作用于小鼠, 造成肝损伤, 而Camptothecin单独作用时没有影响。				
临床实验	N/A				
特征	Camptothecin是大量实验证明具有毒性的植物碱, 是DNA拓扑异构酶I(topo I)的特定抑制剂。				

#### ➤ 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	从小牛胸腺中分离拓扑异构酶I。所有反应在孔板的10ml反应buffer(50mM Tris-HCl(pH7.5)、100mM KCl、0.5mM EDTA和30pg/ml BSA)中进行反应。Camptothecin溶于DMSO, 浓度为10mg/ml, 在96孔板上连续稀释, 加入末端 <sup>32</sup> P标记的pBR322 DNA和拓扑异构酶。反应混合物在室温下温育30分钟, 然后加入2ml 十二烷基硫酸钠(SDS)和蛋白酶K的混合物(终浓度分别为1.6%和0.14mg/ml)终止反应。在50°C下加热实验板30分钟, 加入10ml含0.45N NaOH标准停止混合物, 为了获得单链DNA, 在TBE缓冲液中使用1.5%琼脂糖凝胶对样本进行电泳。凝胶涂抹在硝酸纤维素纸, 烘干, 用X-射线胶片处理。获得IC <sub>50</sub> 值。

细胞实验	
细胞系	U87MG、A549和H838细胞
浓度	0.17nM-10mM
处理时间	48小时
方法	肿瘤细胞按每孔1500到4000个接种在96孔板上,孔中含100μl培养基,培养过夜,使细胞粘附。Camptothecin处理细胞48小时,然后用新鲜培养基再处理48小时。加入四种不同浓Camptothecin。用MTT处理细胞4小时,使用0.2ml DMSO,然后用50μl Sorensen's buffer抽提减少的染料产物。稍微震荡实验孔板,在570nm处读取吸光值。使用四参数方程,根据MTT实验数据,绘制曲线。

动物实验	
动物模型	携带CASE、SW48、DOY、SPA和CLO移植瘤的裸鼠
配制	通过超声波破碎法分散在Intralipid 20%中,浓度为1mg/ml
剂量	0-8mg/kg
给药方式	肌肉注射或静脉注射,每周两次。

➤ **参考文献:**

- 1.Wall ME, et al. J Am Chem Soc. 1966; 88(16):3888-3890.
- 2.Giovanella BC, et al. Cancer Res. 1991; 51(11):3052-3055.
- 3.Luzzio MJ, et al. J Med Chem. 1995; 38(3):395-401.
- 4.Hentze H, et al. Hepatology. 2004; 39(5):1311-1320.
- 5.Cheng F, et al. Oncogene. 2011; 30(33):3599-3611.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC0141-10mM	Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0141-5mg	Camptothecin (Topoisomerase抑制剂)	5mg
SC0141-25mg	Camptothecin (Topoisomerase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:**

- 本产品对人体有毒,操作时请特别小心,并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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至管底后再开盖使用。
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