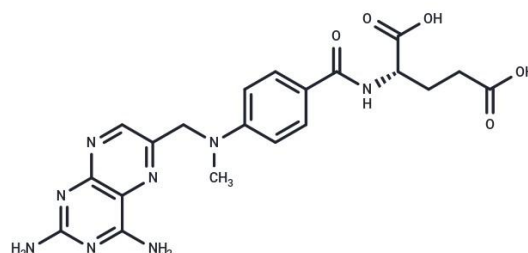


Methotrexate(甲氨蝶呤)(DHFR 抑制剂)

货号: RPM0037

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	Methotrexate(甲氨蝶呤)(DHFR 抑制剂)
别称/Synonyms:	甲 氨 蝶 呤 , NCI-C04671, WR19039, Amethopterin, CL14377
CAS 号/CAS NO.:	59-05-2
化学式/Formula:	$C_{20}H_{22}N_8O_5$
分子量/M.Wt:	454.44
外观/Appearance:	固体
保存条件/Storage:	Powder: -20°C, 3 年 Insolvent: -80°C, 1 年



◆ 溶解信息

溶解度/Solubility:	DMSO:	45 mg/mL (99.02 mM)
	Ethanol:	< 1 mg/mL (不溶或微溶)
	10% DMSO+40% PEG300+5% Tween	8.3 mg/mL (18.26 mM), 现配现用
	80+45% Saline:	

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2005 mL	11.0026 mL	22.0051 mL
5 mM	0.4401 mL	2.2005 mL	4.401 mL
10 mM	0.2201 mL	1.1003 mL	2.2005 mL
50 mM	0.044 mL	0.2201 mL	0.4401 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	Methotrexate 是一种叶酸类似物, 一种二氢叶酸还原酶 DHFR 的抑制剂。Methotrexate 具有抗代谢、抗肿瘤和免疫抑制等活性, 常用于类风湿关节炎和多种肿瘤的研究。
靶点活性/Targets (EC ₅₀)	DHFR (human):24 nM

体外活性/In vitro	人卵巢癌细胞 SKOV-3 用 Methotrexate (15-50 μ M) 处理 24 h, 使用 AO/EtBr probe 检测细胞凋亡情况。结果显示 Methotrexate 诱导 SKOV-3 细胞凋亡。 ^[1]
体内活性/In vivo	为检测在不同类型风湿性关节炎 (RA) 和多发性硬化症 (MS) 模型中的作用模式, 将 Methotrexate (0.1-5 mg/kg) 腹腔注射给不同发病机制的 RA 和 MS 模型, 每天一次, 持续十四天。结果显示 Methotrexate 对 CIA、PIA 等经典 RA 模型及 MS、EAE 模型均有较强的改善作用。Methotrexate 仅在 T 细胞活化之前和依赖于 T 细胞活化的疾病中起作用。 ^[2]
	Compared the in vitro cytotoxicity of methotrexate, aminopterin, pemetrexed, and talotrexin in a panel of six pediatric leukemia and lymphoma cell lines using the sulforhodamine B assay. In addition to defining a 50% growth inhibitory concentration (IC ₅₀) for a 120-h drug exposure, contrasted the activity of the drugs in the context of clinically achievable (tolerable) drug exposures using the area under the plasma concentration-time curve (AUC). Defined each agent's clinical potency index (CPI) as the AUC achieved with standard pediatric dosing regimens divided by the in vitro IC ₅₀ . Aminopterin does not appear to offer any advantage over methotrexate for the treatment of childhood ALL. Further study of pemetrexed in childhood leukemias is warranted. ^[3]

◆ 参考文献

[1] AlBasher G, et al. Methotrexate-induced apoptosis in human ovarian adenocarcinoma SKOV-3 cells via ROS-mediated bax/bcl-2-cyt-c release cascading. *Onco Targets Ther.* 2018 Dec 17;12:21-30.

[2] Lange F, et al. Methotrexate ameliorates T cell dependent autoimmune arthritis and encephalomyelitis but not antibody induced or fibroblast induced arthritis. *Ann Rheum Dis.* 2005 Apr;64(4):599-605.

Norris RE, Adamson PC. Clinical potency of methotrexate, aminopterin, talotrexin and pemetrexed in childhood leukemias. *Cancer Chemother Pharmacol.* 2010 May;65(6):1125-30. doi: 10.1007/s00280-009-1120-8. Epub 2009 Sep 27. PMID: 19784838

◆ 注意事项

1. 请在收到本产品后立即按照说明书中推荐的条件保存, 使用前进行离心, 使粉末充分沉降于管底。
2. 请根据实验目的及本产品的溶解性, 选择相应的溶剂配制高浓度母液后使用, 最佳工作浓度请参考相关文献通过实验摸索优化, 本说明书中的数据来源于公开文献, 仅供参考。
3. 本产品仅供科研使用, 不可用于诊断或治疗领域。
4. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。