

来那度胺; 雷利度胺; Lenalidomide; CC-5013

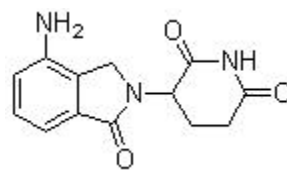
产品编号: MB1136

质量标准: >99.0%,BR

包装规格: 1G;5G

产品形式: powder

基本信息

分子式	C13H13N3O3	结 构 式	
分子量	259.26		
CAS No.	191732-72-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 30mg/ml		
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。		

物理性状及指标:

外观:White-like powder

溶解性:溶于 DMSO : 30mg/ml

纯度:>99.0%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性 (仅来自于公开文献)

产品描述	Lenalidomide (CC-5013)是一种 TNF- α 分泌抑制剂, 在 PBMCs 中 IC50 为 13 nM。
靶点	TNF- α (PBMCs) 13 nM
体外研究	CC-5013 强诱导 IL-2 和 sIL-2R 产量。CC-5013 作用于 T 细胞, 诱导 CD28 的酪氨酸磷酸化, 随后下调 NF- κ B 的激活。Lenalidomide 和 Pomalidomide 作用于表达与 Thalidomide 结合野生型 CRBN 的, 而不是 Thalidomide 结合缺陷型 CRBN(YW/AA)的 HEK293 T 细胞, 抑制 CRBN 自体泛素化。KMS12 多发性骨髓瘤细胞中, CRBN 野生型蛋白而不是 CRBN(YW/AA) 突变型蛋白的过表达, 放大 Pomalidomide 调节的 c-myc 和 IRF4 表达降低和 p21(WAF-1) 表达增高。H929 多发性骨髓瘤细胞系中长期抗 Lenalidomide 的选择性与 CRBN 降低相关,然而抗 Pomalidomide 和 Lenalidomide 的 DF15R 多发性骨髓瘤 中, 检测不到 CRBN 蛋白。Lenalidomide 通过下调肿瘤细胞抑制性分子表达而抑制缺陷发生。Lenalidomide 防止肿瘤诱导的 T 细胞裂解功能障碍发生。Lenalidomide 作用于 T 细胞, 抑制慢性淋巴细胞性白血病 (CLL) 细胞诱导的 T 细胞肌动蛋白突触功能受损, 且下调 CLL 抑制配体及其他受体的表达。Lenalidomide 作用于 FL, DLBCL, HL, MM, SCC,和 OC, 抑制肿瘤诱导的免疫抑制, 且作用于所有检测的肿瘤细胞时,下调免疫抑制配体表达
体内研究	口服处理 Lenalidomide, 显著抑制 bFGF 诱导的血管生成, 这种作用存在剂量依赖性。Lenalidomide 显著降低血管面积百分数, 从对照组的 5.16%降低到实验组的 2.58 (50 mg/kg 剂量处理) 和 1.69 (250 mg/kg 剂量处理)。Lenalidomide 显著降低全部 MVL, 从对照

	组的 21.07 降低到实验组的 8.11 (50 mg/kg 剂量处理) 和 1.90 (250 mg/kg 剂量处理)。
--	--

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。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.8571 mL	19.2857 mL	38.5713 mL
5 mM	0.7714 mL	3.8571 mL	7.7143 mL
10 mM	0.3857 mL	1.9286 mL	3.8571 mL
50 mM	0.0771 mL	0.3857 mL	0.7714 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>Assay for inhibition of TNF synthesis by human PBMCs: Human PBMCs from normal donors are obtained by Ficoll-Hypaque density centrifugation. Cells (106 cells/mL) are cultured in RPMI supplemented with 10 AB+ serum, 2 mM l-glutamine, 100 U/mL penicillin, and 100 µg/mL streptomycin. Lenalidomide is dissolved in DMSO at 20 mg/mL; further dilution is done with culture medium. The final DMSO concentration in all assays including the controls is 0.25%. Lenalidomide is added to cells 1 hour prior to the addition of LPS. PBMCs (106 cells/mL) are stimulated with 1 µg/mL of LPS from Salmonella minnesota R595. Cells, in triplicate, are incubated with LPS for 18–20 hours at 37 °C in 5% CO2. Supernatants are then harvested and assayed for cytokine levels. In some experiments, supernatants are kept frozen at -70 °C until use. Cell viability is assayed by Trypan blue exclusion dye method. The concentration of TNFα in the culture supernatants is determined by ELISA. Lenalidomide is assayed in a minimum of three separate experiments. Percent inhibition is determined as 100 × [1 - (cytokine(experimental)/cytokine(control))].</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 良性或恶性 B (CLL)细胞, RPMI8226 MM 细胞</p> <p>Concentrations: 1 µM 或 5 nM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method: 使用 CellTracker Blue CMAC 对良性或恶性 B (CLL)细胞(2 × 106)进行染色, 然后使用 2 µg/mL 金黄色葡萄球菌超抗原(sAg) (SEA 和 SEB) 在 37oC 下进行脉冲处理 30 分钟。B 细胞和等量 T 细胞(从原代共培养中纯化的)按 200 × g 转速离心 5 分钟, 然后与 CD8+ T 细胞在 37oC 下温育 10 分钟, 或者与 CD3+ T 细胞温育 20 分钟。使用细胞收集器使细胞转移到显微镜载玻片上, 然后在室温下和 3% 溶于 PBS 的甲醛混合 15 分钟。在完全培养基中加入终浓度为 1 µM 的 Lenalidomide。对照组则使用 DMSO 处理细胞。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 HUVECs 细胞的成年雄性 Sprague–Dawley 大鼠</p> <p>Formulation: 0.5% DMSO</p> <p>Dosages: 50 mg/kg 和 250 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</p>

【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。

部分客户使用美仑产品发表文献举例

●LC-MS/MS method for simultaneous determination of thalidomide, lenalidomide, cyclophosphamide, bortezomib, dexamethasone and adriamycin in serum of multiple myeloma patients.

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：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，请选择用合适溶剂，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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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，这种产品需要放置在干燥器中保存。