

来氟米特; Leflunomide

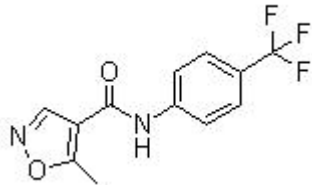
产品编号: MB1575

质量标准: $\geq 98.5\%$

包装规格: 100MG; 1G

产品形式: 粉末

基本信息

分子式	C ₁₂ H ₉ F ₃ N ₂ O ₂	结构式	
分子量	270.21		
CAS No.	75706-12-6		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	Water: Insoluble Ethanol: 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:白色粉末

熔点:165.0~168.0°C

溶解性:Ethanol: 30mg/mL; Water: Insoluble

含量: $\geq 98.5\%$

生物活性 (仅来自于公开文献)

产品描述	Leflunomide 是免疫抑制剂, 其活性代谢产物为 A77 1726(RS-61980)。
靶点	Dihydroorotate dehydrogenase
体外研究	Leflunomide 实际上是药物前体, 在体内加工成活性代谢物 A771726, 这已被证明能抑制单核细胞和 T 细胞的增殖。Leflunomide 是几种蛋白酪氨酸激酶的抑制剂, 在体外的细胞和酶测定中 IC ₅₀ 值在 30 mM 和 100 mM 之间。Leflunomide 能够抑制抗 CD3-和白细胞介素-2 (IL-2) 刺激的 T 细胞增殖。在体外酪氨酸激酶测定中, Leflunomide 能够抑制 p59fyn 和 p56lck 活性。Eflunomide 也抑制 Jurkat 细胞中抗 CD3 抗体刺激的钙动员, 而不影响 ionomycin 刺激的钙动员。Leflunomide 也抑制抗 CD3 单克隆抗体刺激的反应, 如人 T 淋巴细胞中 IL-2 产生和 IL-2 受体表达。Leflunomide 也抑制 CTLL-4 细胞中 IL-2 刺激的酪氨酸磷酸化。Leflunomide 是一种免疫调节药物可通过抑制线粒体酶二氢乳清脱氢酶 (DHODH) 发挥作用, 它在从头合成的嘧啶核糖核苷酸尿苷一磷酸的过程中发挥关键作用。由于生产 rUMP 的不足和涉及 p53 的机制, Leflunomide 通过细胞周期进程的干扰防止激活与自身免疫性淋巴细胞的扩大。

体内研究	在啮齿动物，狗，猴等中，Leflunomide 能够防止和逆转同种异体移植体和异种移植体排斥。
-------------	---

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。本品为一个具有抗增殖活性的异 唑类免疫抑制剂，其作用机理主要是抑制二氢乳清酸脱氢酶的活性，从而影响活化淋巴细胞的嘧啶合成。体内外试验表明本品具有抗炎作用。来氟米特的体内活性主要通过其活性代谢产物 A771726(M1)而产生。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.7008 mL	18.5041 mL	37.0083 mL
5 mM	0.7402 mL	3.7008 mL	7.4017 mL
10 mM	0.3701 mL	1.8504 mL	3.7008 mL
50 mM	0.0740 mL	0.3701 mL	0.7402 mL

【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。

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(M ²)	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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。