

Cilengitide ; EMD121974 ; NSC 707544 ; 西仑吉肽

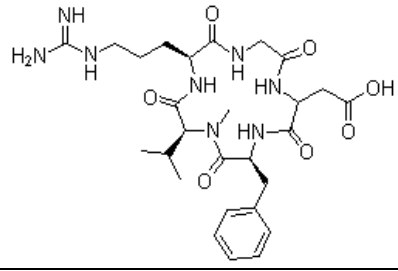
产品编号 : MB5630

质量标准 : >97%, integrin 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C27H40N8O7	结 构 式	
分子量	588.66		
CAS No.	188968-51-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO ≥ 44 mg/mL H ₂ O: ≥ 32 mg/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。		

简介 : 西仑吉肽 Cilengitide 是有效, 选择性的 $\alpha_v\beta_3$ 和 $\alpha_v\beta_5$ 受体整合素抑制剂。

别名 : EMD 121974 ; Cyclo(L-arginylglycyl-L- α -aspartyl-D-phenylalanyl-N-methyl-L-valyl)

物理性状及指标 :

外观 :白色至淡黄色固体

溶解性 :DMSO ≥ 44 mg/mL ; H₂O: ≥ 32 mg/mL

含量 :>97%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Cilengitide 是有效, 选择性的 $\alpha_v\beta_3$ 和 $\alpha_v\beta_5$ 受体整合素抑制剂, IC ₅₀ 分别为 4 和 79 nM。
靶点	IC ₅₀ : 4 and 79 nM ($\alpha_v\beta_3$ and $\alpha_v\beta_5$)
体外实验	西仑吉肽 (EMD 121974) 是 $\alpha_v\beta_3$ 和 $\alpha_v\beta_5$ 整联蛋白受体拮抗剂。在评估人黑素瘤 M21 或 UCLA-P3 人肺癌细胞系的细胞粘附研究中, 西仑吉肽抑制整联蛋白介导的与玻连蛋白的结合, IC ₅₀ 为 0.4 和 0.4 μ M。西仑吉肽的体外治疗浓度大于 1 μ M, 显示浓度和时间依赖性细胞毒性作用。然而, 较低剂量的西仑吉肽单一疗法 (0.1 和 0.5 μ M) 不会引起 U87MG 和 U251MG 细胞的有效死亡。在 U87MG 细胞中观察到显著的细胞毒性作用, 其中加入 1 μ M 西仑吉肽与 Belotecan 单一疗法组合, 浓度为 6.25 nM。与较低浓度的西仑吉肽 (1 μ M) 相比, 较高浓度的西仑吉肽 (5 和 25 μ M) 不会显著增加 U87MG 和 U251MG 中的细胞死亡。

体内实验	在携带 M21-L 黑素瘤肿瘤的裸鼠中，西仑吉肽剂量 i.p. 每周 3 次，10 次，50 次和 250 μ g，肿瘤生长抑制，肿瘤体积减少（分别为 55%，75%和 89%）和肿瘤重量（23%，38%和 61%），分别），与对照相比。在研究的大鼠模型中，i.p. 的全身药代动力学。西仑吉肽不受 ILP 单用西仑吉肽或 ILP 与西仑吉肽加美法仑，TNF 或两者的影响。系统性西仑吉肽水平在腹膜内注射 10 分钟内达到约 20 μ g/ mL (约 35 μ M)。施用并在第一个小时内持续升至约 40 μ g/ mL (约 70 μ M)。此后血清中的西仑吉肽水平下降，消除半衰期为 2.1 小时。
-------------	--

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4104	c(RGDfK)
MB4703	Cyclo(RGDyK)
MB4057	RGD

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。本品西仑吉肽 Cilengitide 是有效，选择性的 $\alpha_v\beta_3$ 和 $\alpha_v\beta_5$ 受体整合素抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6988 mL	8.4939 mL	16.9877 mL
5 mM	0.3398 mL	1.6988 mL	3.3975 mL
10 mM	0.1699 mL	0.8494 mL	1.6988 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	西仑吉肽制备成生理盐水无菌液。在盐水中稀释至 1mM 的浓度。 用细胞计数 Kit-8 (CCK-8)检测两种药物 Belotecan 和 Cilengitide 的细胞毒性。U87MG 和 U251MG 细胞在 96 孔板的播种密度的 4×10^3 细胞/允许粘附在一夜之间。之后,细胞治疗 Cilengitide 浓度为 0,0.1,0.5,1、5 和 25 μ M Belotecan 浓度为 0,6.25,12.5,25、50 和 100 海里。所有可能的浓度组合用于评估西仑吉肽和贝罗替康的联合治疗效果。3 天后,10 μ L CCK-8 的解决方案是添加到每个盘子,盘子是孵化孵化器 3 人力资源(37°C;5%的二氧化碳)。样品板的光密度(OD)是在 450 nm 的微板阅读器上测量的。通过计算每个样本中特定 OD 与对照 OD 的比值来评估肿瘤细胞的生存能力。每个实验一式四份。对这些值进行平均和归一化，以生成剂量响应曲线。
动物实验	西仑吉肽用盐水制备。 小鼠 将 8 周龄的雄性 Balb / c-nu 小鼠随机分为 4 组：对照组 (n = 10)，西仑吉肽组 (n =

	<p>10)，Belotecan 组 (n = 10) 和组合组 (n = 10)。西仑吉利以每天 20mg / kg 的剂量腹腔内给药，Belotecan 以每 10 天 10mg / kg 的剂量给药。计算最佳剂量。对照组动物仅注射盐水。单剂量的药物包括 3 秒输注，体积为 3mL / kg。在肿瘤细胞植入后第 7 天开始药物治疗 16 天。在植入肿瘤细胞后 1 个月处死一半动物用于肿瘤体积分析，并且观察其余动物另外 2 个月以分析存活。动物的死亡定义为体重减轻超过初始体重的 25% 或意外突然死亡。</p> <p>大鼠</p> <p>雄性近交系棕色挪威大鼠 (250 至 300g) 腹腔内注射。在分离肢体灌注前 2 小时和 3 小时后用 50mg / kg 西仑吉肽或盐水。大鼠用于研究灌注各种组合的美法仑，TNF 和西仑吉肽的效果，有或没有额外的 i.p. 在 ILP 程序本身之前和之后施用西仑吉肽。i.p. 施用 ILP 之前和之后的施用旨在最佳地使可用的 αVβ3 和 αVβ5 整联蛋白饱和。盐水在 i.p. 中用作对照。和灌注设置。</p>
--	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做好预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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(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。