

HB181129

Lenalidomide 来那度胺

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Lenalidomide 来那度胺	50809ES50	50 mg
Lenalidomide 来那度胺	50809ES60	100 mg

产品描述

Lenalidomide 又称为 CC-5013、Revlimid®, 是 thalidomide 类似物, 也是一种免疫调节药物, 抑制 TNF alpha 分泌 (IC₅₀=13 nM)。Lenalidomide 通过多种机制起作用, 如抗增殖、提高免疫监视、抑制血管生成和破骨细胞形成、并干扰肿瘤微环境中的基质细胞来源的信号。另外, Lenalidomide 降低抗凋亡蛋白表达, 如 Bcl2 和 eIF4E, 并抑制白细胞介素-1 β 和 TNF- α 。此外, Lenalidomide 通过激活免疫细胞, 尤其是自然杀伤 (NK) 细胞和 T 细胞, 可作为免疫调节剂。与 Thalidomide 相比, Lenalidomide 发挥更好的的抗炎和免疫调节作用。与其他药物联合作用, Lenalidomide 可以增强其他药物的抗癌作用, 如 Lenalidomide 可以提高 docetaxel 在体内外的抗前列腺癌作用。

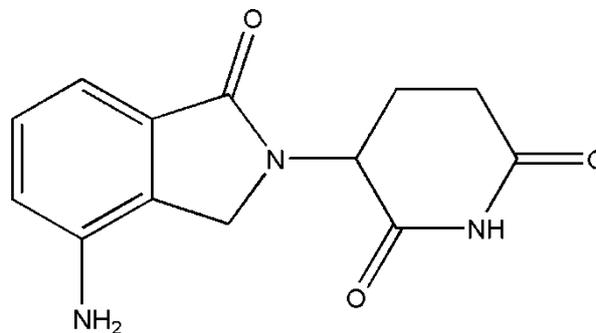
目前, Lenalidomide 进入多发性骨髓瘤 (MM) 治疗的临床 Phase III 研究。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	CC-5013, Revlimid®
化学名 (Chemical Name)	3-(4-amino-1,3-dihydro-1-oxo-2H-isoindol-2-yl)-2,6-piperidinedione
靶点 (Target)	TNF alpha
CAS 号 (CAS NO.)	191732-72-6
分子式 (Molecular Formula)	C ₁₃ H ₁₃ N ₃ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	259.3
外观 (Appearance)	白色或淡黄色粉末
纯度 (Purity)	≥98.5%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。

粉末直接保存于 -20 °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO, 建议分装后 -20 °C 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

为检测 Lenalidomide 对 CRBN 的作用，用 0-1000 μM Lenalidomide 孵育人 CRBN-DDB1 复合物，Lenalidomide 剂量依赖性抑制 CRBN-DDB1 结合， IC_{50} 为 3 μM 。^[3]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，给小鼠不同剂量 Lenalidomide（15 mg/kg, IV; 22.5 mg/kg, IP; 45 mg/kg, PO），该剂量 Lenalidomide 不会产生明显的细胞毒性。^[5]

参考文献

- [1] Muller GW, et al. Amino-substituted thalidomide analogs: potent inhibitors of TNF-alpha production. *Bioorg Med Chem Lett.* 9(11): 1625-1630 (1999).
- [2] Zangari M, et al. Immunomodulatory drugs in multiple myeloma. *Expert Opin Investig Drugs.* 14(11): 1411-1418 (2005).
- [3] Lopez-Girona A, et al. Cereblon is a direct protein target for immunomodulatory and antiproliferative activities of lenalidomide and pomalidomide. *Leukemia.* 26(11): 2326-2335 (2012).
- [4] Dredge K, et al. Orally administered lenalidomide (CC-5013) is anti-angiogenic in vivo and inhibits endothelial cell migration and Akt phosphorylation in vitro. *Microvasc Res.* 69(1-2): 56-63 (2005).
- [5] Rozewski DM, et al. Pharmacokinetics and tissue disposition of lenalidomide in mice. *AAPS J.* 14(4): 872-882 (2012).
- [6] Henry JY, et al. Lenalidomide enhances the anti-prostate cancer activity of docetaxel in vitro and in vivo. *Prostate.* 72(8): 856-867 (2012).