



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Cl-amidine hydrochloride**

CAS 号: **1373232-26-8**

产品货号: **T19531**

生物活性:

Description	Cl-amidine hydrochloride is an orally active peptidylarginine deiminase (PAD) inhibitor, with IC50 values of 0.8 μM, 6.2 μM and 5.9 μM for PAD1, PAD3, and PAD4, respectively. Cl-amidine hydrochloride induces apoptosis in cancer cells. Cl-amidine hydrochloride induces microRNA (miR)-16 (miRNA-16, microRNA-16) expression and causes cell cycle arrest. Cl-Amidine hydrochloride prevents histone 3 citrullination and neutrophil extracellular trap formation, and improves survival in a murine sepsis model[1][2][3][4][5].				
IC50 & Target	IC50: 0.8 μM (PAD1), 5.9 μM (PAD4), 6.2 μM (PAD3)[1][5].				
In Vitro	Cl-amidine hydrochloride 是一种生物可利用的基于卤代乙脒的化合物,可抑制所有活性 PAD 同工酶,效力接近相等 (kinact/KI=13, 000 M-1 min-1 for PAD4)[1]。 Cl-amidine hydrochloride (0、5、10、15、20、25、50 μg/mL, 24 小时) 诱导 TK6 类淋巴母细胞和 HT29 结肠癌细胞的细胞凋亡呈剂量依赖性。有趣的是, 结肠癌细胞系 (HT29) 对 Cl-amidine hydrochloride 引起的细胞凋亡具有相对抵抗力[2]。 Cl-amidine hydrochloride 阻止组蛋白 3 瓜氨酸化和中性粒细胞胞外陷阱的形成, 并改善在小鼠败血症模型中存活[4]。 Cell Line: TK6 lymphoblastoid cells and HT29 colon cancer cells. Concentration: 0, 5, 10, 15, 20, 25, 50 μg/mL. Incubation Time: 24 h. Result: Induced apoptosis dose-dependently.				
In Vivo	Cl-amidine (75 mg/kg, 每天一次, 腹腔注射) 抑制和处理 DSS 诱导的小鼠结肠炎[2]。 Cl-amidine (5、25、75 mg/kg, 口服强饲法, 每天一次) 导致组织学评分显著降低, 且呈剂量依赖性[2]。				
	Animal Model:	C57BL/6 mice (8-12 wk old, DSS mouse model of colitis)[2].			
	Dosage:	75 mg/kg.			
	Administration:	IP once daily.			
	Result:	Suppressed PAD activity, protein citrullination, and PAD levels in the colon in vivo.			
	Animal Model:	C57BL/6 mice (8-12 wk old, DSS mouse model of colitis)[2].			
	Dosage:	5, 25, 75 mg/kg.			
	Administration:	Oral gavage once daily.			
	Result:	Led to significant reductions in the histology scores.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (143.99 mM; 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.8799 mL	14.3993 mL	28.7985 mL
		5 mM	0.5760 mL	2.8799 mL	5.7597 mL
		10 mM	0.2880 mL	1.4399 mL	2.8799 mL
* 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。					



	储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen, away from moisture)。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.60 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.60 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.60 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶。 方案 一 请依序添加每种溶剂: PBS Solubility: 5.5 mg/mL (15.84 mM); 澄清溶液; 超声助溶
参考文献	[1]. Yuan Luo, et al. Inhibitors and Inactivators of Protein Arginine Deiminase 4: Functional and Structural Characterization. Biochemistry. 2006 Oct 3; 45(39): 11727–11736. [2]. Chumanovich AA, et al. Suppression of colitis in mice by Cl-amidine: a novel peptidylarginine deiminase inhibitor. Am J Physiol Gastrointest Liver Physiol. 2011 Jun;300(6):G929-38. [3]. Witalison EE, et al. Molecular targeting of protein arginine deiminases to suppress colitis and prevent colon cancer. Oncotarget. 2015 Nov 3;6(34):36053-62.



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

[4]. Biron BM, et al., Cl-Amidine Prevents Histone 3 Citrullination and Neutrophil Extracellular Trap Formation, and Improves Survival in a Murine Sepsis Model. J Innate Immun. 2017;9(1):22-32.

完整储备液配制表:

* 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。储备液的保存方式和期限:-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen, away from moisture)。-80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.8799 mL	14.3993 mL	28.7985 mL	71.9963 mL
	5 mM	0.5760 mL	2.8799 mL	5.7597 mL	14.3993 mL
	10 mM	0.2880 mL	1.4399 mL	2.8799 mL	7.1996 mL
	15 mM	0.1920 mL	0.9600 mL	1.9199 mL	4.7998 mL
	20 mM	0.1440 mL	0.7200 mL	1.4399 mL	3.5998 mL
	25 mM	0.1152 mL	0.5760 mL	1.1519 mL	2.8799 mL
	30 mM	0.0960 mL	0.4800 mL	0.9600 mL	2.3999 mL
	40 mM	0.0720 mL	0.3600 mL	0.7200 mL	1.7999 mL
	50 mM	0.0576 mL	0.2880 mL	0.5760 mL	1.4399 mL
	60 mM	0.0480 mL	0.2400 mL	0.4800 mL	1.1999 mL
	80 mM	0.0360 mL	0.1800 mL	0.3600 mL	0.9000 mL
	100 mM	0.0288 mL	0.1440 mL	0.2880 mL	0.7200 mL