

## 辛伐他汀 ; Simvastatin

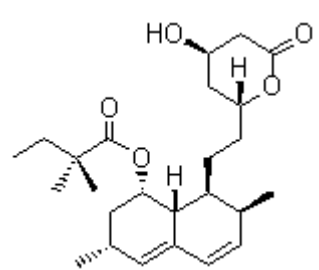
产品编号 : MB1222

质量标准 : &gt;99%,BR,细胞培养级

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>25</sub> H <sub>38</sub> O <sub>5</sub>	结构式	
分子量	418.57		
CAS No.	79902-63-9		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 83 mg/mL (198.29 mM) Ethanol : 83 mg/mL (198.29 mM) 溶于氯仿、乙腈、甲醇		
	略溶于丙二醇, 极微溶于正己烷		
	几乎不溶于水		
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 : .....白色或类白色结晶性粉末

熔点 : .....127-132 °C (lit.)

溶解性 : .....83 mg/mL 易溶于 DMSO 及乙醇 ; 溶于氯仿、乙腈、甲醇 ; 略溶于丙二醇, 极微溶于正己烷 ; 几乎不溶于水

 密度 : .....1.11 g/cm<sup>3</sup>

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....98.0% ~ 102.0%

 IC<sub>50</sub> : .....HES : IC<sub>50</sub> = 6.5 nM ; HMG-CoA 还原酶 : IC<sub>50</sub> = 3 nM ;

 .....半数致死剂量 (LD<sub>50</sub>) 经口 - 大鼠 - 4,438 mg/kg

 .....半数致死剂量 (LD<sub>50</sub>) 腹膜内的 - 大鼠 - 705 mg/kg

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Simvastatin 是一种 HMG-CoA reductase 竞争性抑制剂, 无细胞试验中 K <sub>i</sub> 为 0.1-0.2 nM。		
<b>靶点</b>	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td>HMG-CoA reductase (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>0.1-0.2 nM(K<sub>i</sub>)</td> </tr> </table>	HMG-CoA reductase (Cell-free assay)	0.1-0.2 nM(K <sub>i</sub> )
HMG-CoA reductase (Cell-free assay)			
0.1-0.2 nM(K <sub>i</sub> )			
<b>体外研究</b>	在细胞试验中, 用之前, Simvastatin 需要使用 NaOH 的 EtOH 溶液激活。Simvastatin 抑制小鼠 L-M cell (成纤维细胞), 大鼠 H4II E 细胞(肝脏), 以及人类 Hep G2 细胞(肝脏)中胆固醇合成, IC <sub>50</sub> 值分别为 19.3 nM, 13.3 nM 和 15.6 nM。Simvastatin 治疗在 30 分钟内导致剂量依赖性 Akt 丝		

	氨酸 473 的磷酸化, 1.0 $\mu$ M 下具有最大磷酸化作用。Simvastatin (1.0 $\mu$ M) 增强内源性 Akt 基质内皮型一氧化氮合酶(eNOS)的磷酸化作用, 抑制无血清培养基中的细胞凋亡, 并加速血管结构的形成。Simvastatin 表现出体外抗炎作用。Simvastatin (10 $\mu$ M) 减少抗-CD3/抗-CD28 抗体刺激的 PB 衍生的单核细胞以及从风湿性关节炎血液和 IFN- $\gamma$ 释放的滑液细胞的增殖。Simvastatin (10 $\mu$ M) 抑制~30%的细胞介导的同种相互作用诱导的巨噬细胞 TNF- $\gamma$ 释放。
<b>体内研究</b>	Simvastatin 口服给药抑制放射性乙酸盐转化为胆固醇, IC50 为 0.2 毫克/千克。高胆固醇饮食喂养的兔子, Simvastatin (4 毫克/天)口服给药 13 周使增加的胆固醇诱导的总胆固醇量、LDL 胆固醇以及 HDL 胆固醇恢复正常水平。在含有 0.25%胆固醇饮食喂养的兔子体内, Simvastatin (6 毫克/千克)增加 LDL 受体依赖性结合, 也使肝脏 LDL 受体数量增加。Simvastatin 对炎症的影响与它对血浆胆固醇水平的作用无关。在食用高脂饮食的食蟹猴体内, Simvastatin (20 毫克/千克/天)诱导病灶中巨噬细胞减少 1.3 倍, 血管细胞粘附分子-1, 白细胞介素-1 $\beta$ , 和组织因子的表达减少 2 倍, 并伴随着皮损平滑肌细胞和胶原蛋白含量增加 2.1 倍。

**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。本品为甲基羟戊二酰辅酶 A(HMG-COA)还原酶抑制剂，抑制内源性胆固醇的合成，为血脂调节剂。文献资料表明，有降低高脂血症家兔血清、肝脏、主动脉中胆固醇(TC)的含量，降低极低密度脂蛋白胆固醇(VLDL-C)，低密度脂蛋白胆固醇(LDL-C)水平的作用。

**储液配置**

体 积 \ 质 量 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3891 mL	11.9454 mL	23.8909 mL
5 mM	0.4778 mL	2.3891 mL	4.7782 mL
10 mM	0.2389 mL	1.1945 mL	2.3891 mL
50 mM	0.0478 mL	0.2389 mL	0.4778 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。

**部分客户使用美仑产品发表文献举例**

- Simvastatin inhibits the proliferation of A549 lung cancer cells through oxidative stress and up-regulation of SOD2.
- Decreased exposure of simvastatin and simvastatin acid in a rat model of type 2 diabetes.
- Simvastatin Alleviates Pathology in a Rat Model of Preeclampsia Involving ERK/MAPK Pathway.

### 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。