

Fenofibrate ; 非诺贝特

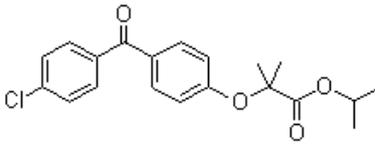
产品编号 : MB1349

质量标准 : >99%,BR

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 ₂₀ H ₂₁ ClO ₄	结构式	
分子量	360.84		
CAS No.	49562-28-9		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 72 mg/mL (199.53 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 46 mg/mL (127.48 mM)		
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 : 非诺贝特 Fenofibrate 是一种有效的 CYP2C19 和 CYP2B6 抑制剂, IC₅₀ 分别为 0.2 μM 和 0.7 μM。

Fenofibrate 也是 PPARα 激动剂, EC₅₀ 为 30 μM。

别名 : 非诺贝特 ; Fenofibrate ; Procetofen;

Trilipix; Sedufen; 2-[4-(4-Chlorobenzoyl)phenoxy]-2-methylpropanoic acid isopropyl ester

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

熔点 :78~82°C

溶解性 :溶于丙酮, 乙醚, DMSO (15 mg/ml), DMF (30 mg/ml), 乙醇(1 mg/ml),
甲醇(微溶), 苯, 氯仿, 乙酸乙酯, 乙腈和己烷; 不溶于水。

密度 :1.18 g/cm³ (预测)

干燥失重 :≤0.5%

含量 :>99%

IC₅₀ :多巴胺转运体 : IC₅₀ = 8.63 μM (人); 乙酰胆碱酯酶 : IC₅₀ = 15.55 μM (人);

.....LoVo : IC₅₀ = 13.2 μM (人); 血清素 2a 受体 : IC₅₀ = 2.12 μM (人);

.....ADORA3 蛋白 IC₅₀ = 5.7 μM (人) 过氧化物酶体增殖物激活受体 α IC₅₀ = 1 μM (人);

.....PPARα: EC₅₀ = 18 μM (人); PPARα: EC₅₀ = 30 μM (人)

.....半数致死剂量 (LD₅₀) 经口 - 大鼠 - > 2,000 mg/kg

储存条件 : 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Fenofibrate 是一种 Fibrate 类化合物, 是纤维酸衍生物。					
靶点	CYP2C19	CYP2B6	CYP2C9	CYP2C8	CYP3A4	PPARα
	0.2 μM (IC ₅₀)	0.7 μM (IC ₅₀)	9.7 μM (IC ₅₀)	4.8 μM (IC ₅₀)	142.1 μM (IC ₅₀)	30 μM (IC ₅₀)

体外研究	非诺贝特是一种相对有效的 CYP2B6 抑制剂 ($IC_{50} = 0.7 \pm 0.2 \mu M$) 和 CYP2C19 ($IC_{50} = 0.2 \pm 0.1 \mu M$) 。非诺贝特也是 CYP2C8 ($IC_{50} = 4.8 \pm 1.7 \mu M$) 和 CYP2C9 ($IC_{50} = 9.7 \mu M$) 的中度抑制剂。非诺贝特以高于 PPAR α 的亲合力结合并抑制细胞色素 P450 环加氧酶 (CYP) 2C。非诺贝特是一种众所周知的 PPAR α 激动剂, 但对 209 种常用处方药和相关异生素的体外评估表明, 非诺贝特也是细胞色素 P450 环加氧酶 (CYP) 2C 的有效抑制剂。非诺贝特对 CYP2C 的亲合力比对 PPAR α ($EC_{50} = 30 \mu M$) 高 > 10 倍 ($EC_{50} = 2.39 \pm 0.4 \mu M$) 。低剂量的非诺贝特抑制 CYP2C8 活性而不激活 PPAR α 。
体内研究	在这种低剂量 (10 μg / g /天) 下每日摄入非诺贝特可抑制由 CYP2C8 过表达诱导的视网膜和脉络膜新血管形成, 分别为 29% ($P = 0.021$) 和 36% ($P = 1.2 \times 10^{-9}$) 。

美仑相关产品推荐

MB1349-S	Fenofibrate (标准品)
MB21009	二氢非诺贝特-d6

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。本品为氯贝丁酸衍生物类血脂调节药，通过抑制极低密度脂蛋白和甘油三酯的生成并同时使其分解代谢增多，降低血低密度脂蛋白、胆固醇和甘油三酯；还使载脂蛋白 A1 和 A11 生成增加，从而增高高密度脂蛋白。本品尚有降低正常人及高尿酸血症患者的血尿酸作用。动物实验表明，非诺贝特具有致畸性和致癌性。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7714 mL	13.8569 mL	27.7139 mL
5 mM	0.5543 mL	2.7714 mL	5.5428 mL
10 mM	0.2771 mL	1.3857 mL	2.7714 mL
50 mM	0.0554 mL	0.2771 mL	0.5543 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	非诺贝特, 他汀类药物 (阿托伐他汀, 洛伐他汀, 普伐他汀, 辛伐他汀和辛伐他汀, 辛伐他汀的活性形式) 和格列吡嗪对重组人 CYP1A2, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6 和 CYP3A4 的半数抑制浓度 (IC_{50} s) 使用荧光 CYP450 抑制测定法测定。简而言之, 将药物溶解在甲醇或乙腈中。在 96 孔测定板中, 将药物在含有辅因子的溶液中稀释至一系列浓度, 所述辅因子包括 NADP + (终浓度 1.3mM), MgCl ₂ (终浓度 3.3mM), 葡萄糖-6-磷酸 (G6P, 终浓度 3.3mM) 和葡萄糖-6-磷酸脱氢酶 (终浓度 0.4U / mL)。将混合物在 37°C 下预温育 10 分钟。将酶和荧光底物在磷酸钠反应缓冲液 (pH 7.4, 终浓度 200mM) 中稀释至所需浓度并混合。通过将酶和底物混合物添加到辅因子和药物混合物中来开始反应。所有测定的最终反应体积为 200 μ L。在 37°C 下孵育预定的一段时间 (15 至 45 分钟) 后加入 75 μ L 猝灭溶液 (0.5M Tris 碱或 2N NaOH) 终止反应。使用 BioTek Synergy 2 荧光读数器测定荧光。每种药物以八种浓度一式两份进行测试。为了估计 IC_{50} , 使用针对背景校正的净荧光计算抑制百分比。然后将抑制百分比的值拟合到三或四参数对数 - 逻辑模型。
动物实验	对于较高剂量 (100mg / kg /天), 将非诺贝特溶解在玉米油 (小鼠) 中。 对于较低剂量的治疗 (10mg / kg /天), 将非诺贝特溶解在 10% DMSO 中以制备 10mg / mL 溶液 (小鼠)。

	<p>小鼠</p> <p>使用小鼠氧诱导的视网膜病 (OIR) 模型。简言之, 为诱导视网膜新生血管形成, 小鼠幼仔及其哺乳母亲暴露于 P7 至 P12 的 $75 \pm 3\%$ 氧气。用于较高剂量的非诺贝特 (F6020) 治疗 (100mg / kg / 天)。将非诺贝特溶解在玉米油中以制备 100mg / mL 溶液, 并使用纯玉米油作为媒介物对照。对于较低剂量的治疗 (10mg / kg / 天), 将非诺贝特溶解在 10%DMSO, D2650 中以制备 10mg / mL 溶液, 并使用 10%DMSO 作为媒介物对照。回到室内空气后, 每天从 P12 到 P16 口服强尼非贝特 (100 或 10mg / kg) 或媒介物对照小鼠。在 P17, 在安乐死后立即摘出眼, 并在室温下在 PBS 中的 4% 多聚甲醛中固定 1 小时。然后解剖视网膜并在室温下用 Alexa Fluor 594 缀合的同工凝集素 GS-IB4 (10μg / mL) 染色过夜。用 PBS 洗涤后, 将视网膜安装到显微镜载玻片上, 感光体侧朝下并嵌入 SlowFade 抗褪色封固剂中。使用具有图像软件的荧光显微镜拍摄视网膜图像。分析视网膜新血管形成。</p>
--	--

【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。

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。