

## Rosuvastatin Calcium ; 瑞舒伐他汀钙 ; 罗苏伐他汀钙

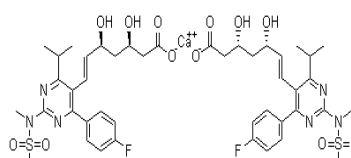
产品编号 : MB1495

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 白色至黄色粉末

### 基本信息

分子式	2(C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S).Ca;C <sub>44</sub> H <sub>54</sub> CaF <sub>2</sub> N <sub>6</sub> O <sub>12</sub> S <sub>2</sub>	结构式	
分子量	1001.14		
CAS No.	147098-20-2		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL warmed (199.77 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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:** 瑞舒伐他汀钙 Rosuvastatin 钙盐是 HMG-CoA 还原酶抑制剂, IC<sub>50</sub> 为 11 nM。

**别名:** Rosuvastatin hemicalcium; ZD 4522 Calcium ; 6-Heptenoic acid, 7-[4-(4-fluorophenyl)-6-(1-methylethyl)-2-[methyl(methylsulfonyl)amino]-5-pyrimidinyl]-3,5-dihydroxy-, calcium salt (2:1), (3R,5S,6E)

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至黄色粉末

熔点 : .....122-123°C (lit.)

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL warmed (199.77 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 : .....>98%,BR

**储存条件 :** 2-8°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Rosuvastatin Calcium 是一种竞争性 <b>HMG-CoA reductase</b> 抑制剂, 无细胞试验中 <b>IC<sub>50</sub></b> 为 11 nM。
<b>靶点</b>	HMG-CoA reductase (Cell-free assay)  11 nM
<b>体外研究</b>	Rosuvastatin 具有亲水性, 对肝细胞具有高度选择性, 其摄入是通过肝脏特异的有机阴离子转运蛋白 OATP-C 介导的。Rosuvastatin 是 OATP-C 的高亲和性底物, 表观缔合常数是 8.5 μM 在离体的大鼠肝细胞中, Rosuvastatin 抑制胆固醇的合成, IC <sub>50</sub> 是 1.12 nM。与 pravastatin 相比, Rosuvastatin 增加大约 10 倍的 LDL 受体 mRNA 含量。Rosuvastatin (100 μM) 减少 U937 与 TNF-α-激活的 HUVEC 附着的范围。在内皮细胞中, Rosuvastatin 通过抑制 c-Jun 氨基端激酶和核因子-kB 而抑制 ICAM-1, MCP-1, IL-8, IL-6, 和 COX-2 mRNA 的表达以及蛋白水平。
<b>体内研究</b>	Rosuvastatin 能有效减少血浆液体。在胆固醇水平正常的雄性比格犬体内, Rosuvastatin (3 毫克/千克) 给药 14 天, 减少 26% 的血浆中胆固醇含量。在食蟹猴体内, Rosuvastatin 减少血浆中 22%

的胆固醇含量。Rosuvastatin (20 毫克/千克/天)给药 2 周, 显著减少 Streptozocin 诱导的糖尿病大鼠体内极低密度脂蛋白(VLDL)含量。Rosuvastatin 具有体内抗动脉粥样硬化的作用。Rosuvastatin (1.25 毫克/千克) 内皮细胞表面 P-选择素的表达显著抑制凝血酶诱导的单核细胞穿过肠系膜微静脉的移行, 并且使一氧化氮在大动脉中的基础比率增加 2 倍。Rosuvastatin (20 毫克/千克)抑制 ROS 产生, 使一氧化氮依赖性内皮功能正常化, 并且降低 Streptozocin 诱导的糖尿病大鼠体内血小板激活。Rosuvastatin 具有心脏保护活性。在动物模型中, Rosuvastatin (80 毫克)减少梗死面积, 并提高缺血/再灌注后心脏功能。Rosuvastatin 的心脏保护活性可能是因为增加冠状动脉血流量, 降低了 eNOS 表达增加引起的冠状动脉阻力, 随后增加血管内皮细胞中一氧化氮的产生。在小鼠体内, Rosuvastatin (2.0 毫克/千克)通过调节 Racl 蛋白和 NADPH 氧化酶活性减弱经主动脉收缩产生的左心室膨大症状。

**美仑相关产品推荐**

MB21284	N-去甲基罗舒伐他汀二钠盐-d6
MB21281	罗舒伐他汀内酯-d6
MB21285	罗舒伐他汀钠盐-d6
MB1850	瑞舒伐他汀/罗苏伐他汀游离酸
MB1495-S	瑞舒伐他汀钙/罗苏伐他汀钙 (标准品)

**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。瑞舒伐他汀是一种选择性、竞争性的 HMG-CoA 还原酶抑制剂。HMG-CoA 还原酶是 3-羟-3-甲戊二酰辅酶 A 转变成甲羟戊酸过程中的限速酶, 甲羟戊酸是胆固醇的前体。动物试验与细胞培养试验结果显示, 瑞舒伐他汀被肝脏摄取率高, 并具有选择性, 肝脏是降低胆固醇的作用靶器官。体内、体外试验结果显示, 瑞舒伐他汀能增加细胞表面的肝 LDL 受体数量, 由此增强对 LDL 的摄取和分解代谢, 并抑制肝脏 VLDL 合成, 从而减少 VLDL 和 LDL 颗粒的总数量。对于纯合子与杂合子家族性高胆固醇血症患者、非家族性高胆固醇血症患者、混合型血脂异常患者、瑞舒伐他汀能降低总胆固醇、LDL-C、ApoB、非 HDL-C 水平。瑞舒伐他汀也能降低 TG、升高 HDL-C 水平。对于单纯高甘油三酯血症患者, 瑞舒伐他汀有降低总胆固醇、LDL-C、VLDL-C、ApoB、非 HDL-C、TG 水平, 并升高 HDL-C 水平。尚未确定瑞舒伐他汀对心血管发病率与死亡率的影响。

**储液配置**

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9977 mL	9.9886 mL	19.9772 mL
5 mM	0.3995 mL	1.9977 mL	3.9954 mL
10 mM	0.1998 mL	0.9989 mL	1.9977 mL
50 mM	0.0400 mL	0.1998 mL	0.3995 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。

### 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。