

Gemfibrozil; 吉非罗齐

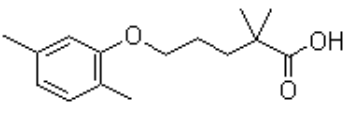
产品编号: MB1561

质量标准: >99%,USP,可用于细胞培养

包装规格: 5G;25G;100G;500G

产品形式: 白色结晶性粉末

基本信息

| | | | |
|-----------|---|-----|---|
| 分子式 | C15H22O3 | 结构式 |  |
| 分子量 | 250.34 | | |
| CAS No. | 25812-30-0 | | |
| 储存条件 | 常温, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性(25°C) | 在三氯甲烷中极易溶解 在氢氧化钠试液中易溶 | | |
| | DMSO: 50 mg/mL (199.73 mM) Ethanol: 50 mg/mL (199.73 mM) | | |
| | Water: 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: Gemfibrozil 是一种 PPAR- α 激活剂, 为一种降脂药; Gemfibrozil 同时是 P450 的非选择性抑制剂, 对 CYP2C9, 2C19, 2C8 和 1A2 的 K_i 值分别为 5.8, 24, 69 和 82 μM 。

别名: CI-719; 2,2-Dimethyl-5-(2,5-dimethylphenoxy)pentanoic acid

物理性状及指标:

外观:白色结晶性粉末;

熔点:58 ~ 61°C

溶解性:在三氯甲烷中极易溶解; 在氢氧化钠试液中易溶; DMSO: 50 mg/mL (199.73 mM); Ethanol: 50 mg/mL (199.73 mM); Water: Insoluble

密度:~1.0 g/cm³ (预测)

含量:>99%,USP,可用于细胞培养

IC₅₀:rat: IC₅₀ >0.40 μM ; CYP2C8: IC₅₀ = 4.1 μM (人); CYP2C9: IC₅₀ = 9.6 μM (人)

.....半数致死剂量 (LD₅₀) 经口 - 大鼠 - 1,414 mg/kg

储存条件: 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | |
|------|--|
| 产品描述 | Gemfibrozil 是一种降低血脂水平的化合物。 |
| 靶点 | PPAR α |
| 体外研究 | 在狗和人肝微粒中, Gemfibrozil 对 CYP3A 介导的 simvastatin hydroxy acid (SVA)的氧化有最小的抑制作用, 但抑制 SVA 葡萄糖醛酸。在狗和人肝微粒中, Gemfibrozil 显著抑制 M-23 的形成, K(i) |

| | |
|-------------|---|
| | (IC50)值为 69 (95) mM, 而抑制 M-1 的形成稍弱, K(i) (IC50)值为 273 mM。在狗和人肝微粒中, Gemfibrozil 强烈地竞争性抑制 CYP2C9 活性, K(i) (IC50)值为 5.8 (9.6) mM。Gemfibrozil 显示对 CYP2C19 和 CYP1A2 活动稍小的抑制作用, K(i) (IC50)值分别为 24 (47) mM 和 82 (136) mM。在人类 U373MG 星形胶质细胞和原代星形细胞中, 降脂药物 Gemfibrozil 抑制细胞因子诱导的 NO 的产生和诱导型一氧化氮合酶 (iNOS) 的表达。Gemfibrozil 诱导过氧化物酶体增殖响应元件 (PPRE) 依赖性荧光素酶活性, 这是为人 PPAR-α 的显性负突变体 DeltahPPAR-α 的表达所抑制。在细胞因子刺激的星形胶质细胞中, Gemfibrozil 强烈抑制 NF-κB, AP-1 和 C/EBPβ 的活化, 但不是 γ 活化位点 (GAS)。 |
| 体内研究 | 在狗中, Gemfibrozil 显著降低 SVA 的血浆清除率 2-3 倍以及 SVA 葡糖苷酸的胆汁排泄 (连同其环化产物 SV), 但不影响 SVA 的主要氧化代谢物的排泄。 |

美仑相关产品推荐

| | |
|----------|------------|
| MB1561-S | 吉非罗齐 (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。本品为氯贝丁酸衍生物类血脂调节药, 其降血脂的作用机制尚未完全明了, 可能涉及周围脂肪分解, 减少肝脏摄取游离脂肪酸而减少肝内甘油三酯形成, 抑制极低密度脂蛋白载脂蛋白的合成而减少极低密度脂蛋白的生成。本品降低血甘油三酯而增高血高密度脂蛋白浓度, 虽可轻度降低血低密度脂蛋白胆固醇血浓度, 但在IV型高脂蛋白血症可能使低密度脂蛋白有所增高。5 年安慰剂对照研究显示本品能减低严重冠心病猝死、心肌梗死的发生。以 10 倍人类剂量长期给大鼠, 肝恶性肿瘤与良性睾丸肿瘤发生率增加。

储液配置

| 体质量 浓度 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|-----------|-----------|------------|------------|
| 1 mM | 3.9947 mL | 19.9736 mL | 39.9473 mL |
| 5 mM | 0.7989 mL | 3.9947 mL | 7.9895 mL |
| 10 mM | 0.3995 mL | 1.9974 mL | 3.9947 mL |
| 50 mM | 0.0799 mL | 0.3995 mL | 0.7989 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|-------------|--|
| 激酶实验 | CYP3A4 的活动(睾酮 6β-hydroxylation)和 CYP2C8(紫杉醇 6α-hydroxylation)确定。使用的标记底物浓度, 25μM 睾酮和 1 - 5μM 紫杉醇, 比得上或周围的 Km 值反应。在与人肝微粒体(0.1 mg/mL)启动反应前, Gemfibrozil 与标记物底物和 NADPH 共孵育 15 分钟, 或与人肝微粒体和 NADPH 预孵育 15 分钟, 然后加入标记物底物。 |
| 细胞实验 | 简而言之, 使 400μL 培养上清液与 200μL Griess 试剂反应, 并在室温下温育 15 分钟。在 570nm 处通过分光光度法测量测定样品的光密度。新鲜培养基在所有实验中都是空白。亚硝酸盐浓度由测定中 NaNO ₂ 反应得到的标准曲线计算。 |
| 动物实验 | 将吉非罗齐溶解在乙醇中, 食物中制备用于口服给药, 溶解在 PBS 中用于腹腔内注射。在 SCI 之前 3 天开始给予小鼠载体或吉非罗齐, 以确保在损伤时药物可用性 (n = 5-6 / 组)。通过将药物溶解在乙醇 (0.25% w / w 吉非罗齐) 中并涂覆食物颗粒使得每只动物接受约 62mg / kg / 天的药物来口服递送药物; 对照组的食物用乙醇处理。在将食物给予动物之前, 允许每组的 |

乙醇完全蒸发。此外，动物在受伤后 1 小时接受腹腔注射载体或吉非贝齐（500μg 溶于 200μL PBS），然后继续在其食物中接受药物直至研究结束（伤后 28 天）。

【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。