

SR12813 ; SR-12813

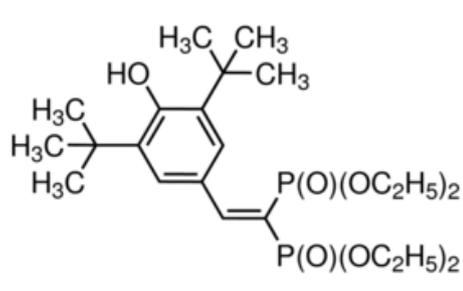
产品编号：MB1780

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG；25MG

产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C24H42O7P2	结 构 式	
分子量	504.53		
CAS No.	126411-39-0		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 100 mg/mL (198.2 mM) Ethanol 100 mg/mL (198.2 mM) H2O: 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：SR12813 是有效的 3-羟基-3-甲基-戊二酰辅酶 A 还原酶 (HMG-CoA reductase) 抑制剂,也是孕烷 X 受体 (PXR) 的激动剂。

别名：Tetraethyl 2-(3,5-di-tert-butyl-4-hydroxyphenyl)ethenyl-1,1-bisphosphonate

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL (198.2 mM)；Ethanol 100 mg/mL (198.2 mM)；H2O: insoluble

纯度：.....>98%，BR

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性：

产品描述	SR 12813 也是 HMGCoA reductase 抑制剂。是具有低胆固醇血症活性的 1,1-双磷酸酯。它通过提高 HMG-CoA 还原酶的降解来降低胆固醇的生物合成。 SR 12813 是孕烷 X 受体 (PXR, NR 112) 激动剂；降胆固醇药物；					
靶点	SR12813 是 3-羟基-3-甲基戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂 IC50: 0.85 μM (HMG-CoA Reductase) SR-12813 是孕烷 X 受体 (PXR) 的激动剂。 <table border="1" data-bbox="343 1668 1053 1803"> <tr> <td>pregnane receptor</td> <td>HMG-CoA reductase</td> </tr> <tr> <td></td> <td>850 nM</td> </tr> </table>		pregnane receptor	HMG-CoA reductase		850 nM
pregnane receptor	HMG-CoA reductase					
	850 nM					
体外研究	作为抑制剂 SR - 12813 抑制氘化水进入胆固醇，IC50 为 1.2μm，但对脂肪酸合成没有影响。此外，SR 12813 减少细胞 3-羟基-3-甲基戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶活性，IC50 为 0.85μm。25-HC 和 SR-12813 都可以通过阻断胆固醇的合成而杀死哺乳动物细胞，因此它们是致死选择的理想试剂。					

	SR - 12813 在 8 ~ 16 μ m 的浓度范围内杀死 HeLa 细胞，SR - 12813 杀死了由 Ad - Cre (SL - 5 + Cre) 感染的野生型细胞和突变细胞，但突变型 SL - 5 在这种条件下存活。SR 12813 或 25-HC 促进野生型 HeLa 和 SL-5 突变细胞中 95 kDa 全长 HMG-CoA 还原酶的降解。 作为激活剂 SR12813 是一种非常有效的人源和兔源 PXR 的激活剂，EC50 分别为 200 nM 和 700 nM。而对大鼠和小鼠 PXR 的激活作用非常微弱。SR-12813 抑制胆汁酸整合到胆固醇中，IC50 为 1.2 μ M，但对脂肪酸合成没有作用。SR-12813 降低胞内 HMG-CoA 还原酶活性，IC50 为 0.85 μ M，它对 HMG-CoA 还原酶活性的抑制非常迅速，T1/2=10 min。
体内研究	SR12813 在很多动物如大鼠、狗和灵长类中能够降低胆固醇水平

美仑相关产品推荐

MB3933	ML-176;SR-3335	SR3335;ML176
MB6750	胆固醇	Cholesterol
MB6601	胆固醇(标准品)	Cholesterol

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。SR 12813 也是 HMGCoA reductase 抑制剂。是具有低胆固醇血症活性的 1, 1-双磷酸酯。它通过提高 HMG-CoA 还原酶的降解来降低胆固醇的生物合成。SR 12813 也是孕烷 X 受体 (PXR, NR 112) 激动剂；降胆固醇药物；SR-12813 在 HepG2 肝癌细胞和 PXR-活化分析中被用于在人类肝细胞中由脱氢表雄酮介导的孕烷 X 受体(PXR)结合检测。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9820 mL	9.9102 mL	19.8204 mL
5 mM	0.3964 mL	1.9820 mL	3.9641 mL
10 mM	0.1982 mL	0.9910 mL	1.9820 mL
50 mM	0.0396 mL	0.1982 mL	0.3964 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	简而言之，将化合物以 Me 2 SO (终浓度，0.1%) 加入细胞中。实验后，通过在室温下添加 0.1mL 的 0.25% Brij 96, 0.1M 蔗糖，0.1M KF，50mM KCl，40mM 二氢磷酸钾，30mM EDTA，5mM 二硫苏糖醇，pH 7.4 来裂解细胞。 在一些实验中，忽略 KF 以测量“总” HMG-CoA 还原酶活性。进一步确定细胞裂解物中的 HMG-CoA 还原酶活性。
细胞实验	Cell lines: HepG2 细胞 Concentrations: 3 μ M Incubation Time: 21 h Method: 在 5% LPDS 细胞培养基中加入 1 μ M lovastatin 或 3 μ M SR-12813，处理 Hep G2 细胞 21 小时，提取 mRNA 进行 Northern blotting 分析。
动物实验	Animal Models: 比格犬

Formulation: 明胶胶囊**Dosages:** 10 mg/kg**Administration:** 口服**【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。