

Anacetrapib ; MK0859 ; 安塞曲匹 ; 胆固醇脂转移蛋白阻滞剂

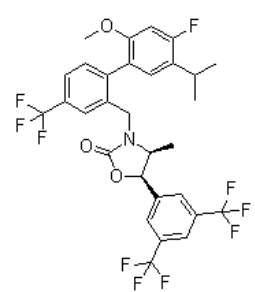
产品编号 : MB1876

质量标准 : >98%

包装规格 : 10MG;100MG;1G

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C30H25F10NO3	结 构 式	
分子量	637.51		
CAS No.	875446-37-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 127 mg/mL (199.21 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 127 mg/mL (199.21 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: 安塞曲匹 Anacetrapib 是一种有效的 **CETP** 抑制剂, 作用于 rhCETP 和 C13S CETP 突变型, **IC₅₀** 分别为 7.9±2.5 nM 和 11.8±1.9 nM。

别名: 安塞曲匹;胆固醇脂转移蛋白阻滞剂; MK 0859;MK-0859;

物理性状及指标:

外观 :powder

溶解性 :DMSO : 127 mg/mL (199.21 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 127 mg/mL (199.21 mM)

含量 :>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Anacetrapib (MK-0859)是一种有效的, 选择性, 可逆的 rhCETP 和 突变 CETP(C13S) 抑制剂, IC₅₀ 分别为 7.9 nM 和 11.8 nM, 提高 HDL-C, 降低 LDL-C, 不提高醛固酮和血压。	
靶点	rhCETP 7.9 nM	Mutant CETP (C13S) 11.8 nM
体外研究	Anacetrapib 选择性有效抑制重组人类 CETP 和 C13S 突变型 CETP, IC₅₀ 分别为 7.9 和 11.8 nM。Anacetrapib 和抑制素一起服用时, 不仅提高 HDL-胆固醇水平, 也进一步降低 LDL-胆固醇水平。Anacetrapib 明显降低 CE 从 HDL3 转变为 HDL2, 这种作用存在剂量依赖性。Anacetrapib 不影响 [¹⁴ C]-dalcetrapibthiol 与人类重组 CETP 的结合数。	
体内研究	每天, Anacetrapib 按 60mg/kg 剂量处理异常仓鼠模型, 持续处理 2 周, 与对照组相比, CETP 活性下降 94%, HDL-胆固醇上升 47%, 非 HDL 胆固醇浓度不受影响。此外, Anacetrapib 促	

	进巨噬细胞胆固醇逆向转运,导致排泄物胆固醇含量上升 30%。与对照组相比,Anacetrapib 处理的仓鼠 HDL 显示 SR-B1 和 ABCG1 调节的流出物增多。按 10 mg/kg 剂量口服处理 [¹⁴ C]Anacetrapib, 48 小时后,鼠和猴分别恢复~80 和 90%放射性。两种动物的排泄物中放射性基本没有变化。
--	--

美仑相关产品推荐

MB4303	Evacetrapib (LY2484595)
CL-11135	Torcetrapib

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。Anacetrapib(MK0859) 是一种有效的,选择性的,可逆的 rhCETP 和突变型 CETP (C13S) 抑制剂,可增加 HDL-C 并降低 LDL-C, 不会增加醛固酮或血压。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.5686 mL	7.8430 mL	15.6860 mL
5 mM	0.3137 mL	1.5686 mL	3.1372 mL
10 mM	0.1569 mL	0.7843 mL	1.5686 mL
50 mM	0.0314 mL	0.1569 mL	0.3137 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	使用 scintillation proximity 检测试剂盒测量 Dalcetrapib, Torcetrapib 和 Anacetrapib 降低 rhCETP 和 C13S CETP 从 HDL 向 LDL 的 CE 转移的抑制效力 (IC50)。简而言之,将[3H] CE 标记的 HDL 供体颗粒在纯化的 CETP 蛋白 (终浓度 0.5μg/ mL) 和生物素化的 LDL 受体颗粒的存在下于 37°C 温育 3 小时。随后,添加含有液体闪烁混合物的链霉抗生物素蛋白偶联的聚乙烯基甲苯珠粒选择性地结合生物素化的 LDL, 并且通过β计数测量转移至 LDL 的[3H] CE 分子的量。
细胞实验	在处理之前,将细胞接种在 96 孔板中过夜,用不同浓度的 CETP 抑制剂 (例如 Anacetrapib) 处理 24 小时。使用 CellTiter-Glo 发光细胞活力测定试剂盒测量细胞活力。在每个实验条件下评估四个孔。
动物实验	<p>小鼠</p> 在受控温度 (72°F) 和照明 (12 小时光照/黑暗循环) 下饲养 8 周龄雄性 C57BL / 6J 小鼠 (4 只动物/笼)。动物可以自由饮用高压灭菌的水和食物。在第一次体内研究中,在 7 天的适应期后,给小鼠喂食含有 35% 卡路里的脂肪和 1.25% 胆固醇的高脂肪高胆固醇饮食 (HFHC), 持续两周。然后将小鼠分成两组 (每组 n = 8), 并通过口服强饲法给予 50mg / kg 的 Anacetrapib 日剂量。对照组接受载体 (0.5% 甲基纤维素)。药物治疗持续 7 天。在第二次体内研究中,喂食正常饲料的小鼠用 Anacetrapib (50mg / kg, n = 8) 或媒介物 (n = 8) 处理 10 天。在药物治疗之前和之后禁食 4 小时后收集血清样品。在最后一次给药后,处死所有动物以收集血清和肝组织。立即取出肝脏,切成小块,并储存在 -80°C, 用于 RNA 和蛋白质分离以及胆固醇测量。 <p>大鼠</p> 在研究之前,将体重为 280 至 330g 的成年雄性 Sprague-Dawley 大鼠禁食过夜。在给药后 4 小时允许动物接触食物,但随意提供水。对于静脉内施用,四只大鼠通过先前植入股静脉的导管推注注射 Anacetrapib 剂量 (剂量体积 2.5mL / kg), 然后用 300μL 盐水冲洗。Anacetrapib

的静脉内剂量配制在聚乙二醇 300-水 (7 : 3 , v / v) 中 , 浓度为 0.2mg / mL 。对于口服给药 , 四只大鼠通过口服强饲法接受剂量 (给药体积 2mL / kg) 。这些 5,50,100 和 500mg / kg 的口服剂量分别以 2.5,25,50 和 250mg / mL 的浓度配制在 Imwitor 742-Tween 80 (1 : 1 , w / w) 中。在以下时间点将血液样品 (0.3mL) 收集到含 EDTA 的管中 : 给药前和 0.083 (仅静脉内) , 给药后 0.25,0.5,1,2,4,6,8,24 和 48 小时。将血液样品储存在冰上 , 并通过离心制备血浆。将血浆转移至 96 孔板中并在 -70°C 下储存直至分析。

【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。