

## Ezetimibe ; 依泽替米贝 ; 依折麦布

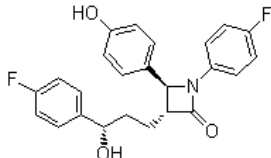
产品编号 : MB1963

质量标准 : >99%

包装规格 : 200MG;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 <sub>24</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> NO <sub>3</sub>	结 构 式	
分子量	409.43		
CAS No.	163222-33-1		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 81 mg/mL (197.85 mM) Water Insoluble Ethanol : 81 mg/mL (197.85 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:** 依泽替米贝 Ezetimibe 是一种 **NPC1L1** 抑制剂, 是有效的 **Nrf2** 激活剂, Ezetimibe (Eze) 是有效的胆固醇吸收抑制剂。

**别名:** 依泽替米贝;依替米贝;Zetia;Ezetrol ; Ezetimibe ; 依折麦布

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或类白色结晶性粉末

熔点 : .....162-164°C

溶解性 : .....DMSO :81 mg/mL (197.85 mM) ;Water Insoluble ;Ethanol :81 mg/mL (197.85 mM)

密度 : .....1.34 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重 : .....≤1.0%

含量 : .....>99%

**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>	Ezetimibe 是一种有效的、选择性的胆固醇吸收抑制剂, 用来降低胆固醇。
<b>靶点</b>	NPC1L1
<b>体外研究</b>	Ezetimibe 显著降低总胆固醇, LDL 胆固醇和甘油三酸酯, 以及适度增加高密度脂蛋白胆固醇。在 Caco-2 细胞中, Ezetimibe 降低 31% 的胆固醇运输, 但不影响黄醇转运。Ezetimibe 导致表面受体 SR-BI, Niemann-Pick C1 型类似蛋白 1, ATP 结合盒转运子, 亚族 A ( ABCA1 ) 和核受体维甲酸受体 ( RAR ) 的 $\gamma$ , 固醇调节元件结合蛋白 ( SREBP ) -1 和-2, 肝 X 受体 ( LXR ) 的 $\beta$ 亚基的 mRNA 的表达显著降低。
<b>体内研究</b>	西式, 含低脂肪且无胆固醇饮食的小鼠中, Ezetimibe 降低血浆胆固醇水平分别从 964 至 374 毫克/分升, 从 726 至 231 毫克/分升, 而从 516 至 178 毫克/分升。Ezetimibe 减少主动脉粥样硬化病变的表面积, 从对照组的 20.2% 到西方饮食组的 4.1% 和低脂肪胆固醇饮食小鼠的 7.0%。

	Ezetimibe 减少颈动脉粥样硬化病变的横截面积，在西部和低脂胆固醇饮食组中为 97%，在无胆固醇的小鼠中为 91%。在西部，低脂肪和无胆固醇的饮食的小鼠中，Ezetimibe 抑制胆固醇吸收，降低血浆胆固醇，增加高密度脂蛋白水平，并抑制动脉粥样硬化。在临床前动物模型中，Ezetimibe 有效抑制胆固醇运输穿过肠壁，从而降低血浆胆固醇血症。在大鼠中，Ezetimibe 消除肠道的胰腺外分泌功能，同时保持胆汁流量。在胆固醇喂养的仓鼠中，Ezetimibe 降低血浆胆固醇和肝胆胆固醇积累，ED50 为 0.04 毫克/千克。
--	--

**美仑相关产品推荐**

MB1963-S	依泽替米贝;依折麦布(标准品)
MB25757	依泽替米贝-d4
MB25759	3-O-乙酰依泽替米贝-d4
MB25758	二醋酸盐依泽替米贝-d4
MB25762	依泽替米贝羟基β-D-葡萄糖苷酸-d4

**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。依泽替米贝是一类新型的选择性胆固醇吸收抑制剂，通过与小肠刷状缘膜小囊泡上膜蛋白（相对分子质量 145X103）结合，抑制小肠对饮食中和经胆汁输送到肠道中的胆固醇的吸收，降低血清和肝脏中的胆固醇含量。与胆酸螯合剂不同，依泽替米贝不影响胆固醇酯、其他甾类（如牛黄胆酸）、三酰甘油和脂溶性维生素的吸收。其药理作用与乙酰辅酶 A-胆固醇乙酰转移酶（ACAT）的抑制及 LDL 受体（清道夫受体）的表达与否无关。依泽替米贝被吸收后在肝脏中与葡萄糖醛酸结合后经肝肠循环，几乎特异地定位于小肠黏膜细胞。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4426 mL	12.2130 mL	24.4260 mL
5 mM	0.4885 mL	2.4426 mL	4.8852 mL
10 mM	0.2443 mL	1.2213 mL	2.4426 mL
50 mM	0.0489 mL	0.2443 mL	0.4885 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>激酶实验</b>	GST-p62 由大肠杆菌制备，0.5μg 纯化的 GST-p62 蛋白用于体外 AMPK 磷酸化测定。通过使用 γS-ATP 的非放射性同位素方法测定 AMPK 对 p62 蛋白的磷酸化。从 HEK293 细胞免疫纯化 AMPK 复合物，用 Flag-AMPKβ1 和 HA-AMPKγ1 转染 myc-AMPKα1 野生型（WT）或 myc-AMPKα1 激酶死亡突变体（KD，D157A）。将 AMPK 复合物加入到含有 20mM HEPES，pH7.4, 1mM EGTA，0.4mM EDTA，5mM MgCl <sub>2</sub> , 0.05mM DTT，0.5μg GST-p62, 0.2mM AMP 和 1mM ATPγS 的反应混合物中。反应在 37°C 下进行 30 分钟，然后加入 20mM EDTA 终止反应。为了检测 γS-标记的 p62 蛋白，将反应产物在室温下用 2.5mM PNBM 烷基化 2 小时，并使用抗硫代磷酸酯抗体通过蛋白质印迹分析产物。
<b>细胞实验</b>	将 Huh7 人肝细胞在含有 10% FBS，100 单位/ mL 青霉素和 100μg/ mL 链霉素的高葡萄糖 DMEM 中于 37°C，95% 空气/ 5% CO <sub>2</sub> 气氛中培养。用或不用依泽替米贝（10μM，1 小时）处理肝细胞，并与棕榈酸（PA，0.5mM，24 小时）一起温育。
<b>动物实验</b>	老鼠 使用 10 周龄的 C57BL / 6J 雄性小鼠。将这些动物随机分配到三组中的一组（每组 7-10 只小鼠）：正常食物；MCD 饮食，载体治疗；或 MCD 饮食，依泽替米贝治疗。小鼠可自由饮食和饮水，温度

保持在  $23\pm 2^{\circ}\text{C}$ ，湿度为  $60\%\pm 10\%$ ，12 小时光照/黑暗循环。在含有依泽替米贝组的 MCD 饮食中，通过口服强饲法每天一次给予依泽替米贝  $10\text{mg}/\text{kg}$ ，持续 4 周。具有赋形剂组的食物和 MCD 饮食接受相同体积的磷酸盐缓冲盐水口服 4 周。在治疗期间每周测量一次体重。4 周后，将小鼠麻醉并杀死；通过心脏穿刺收集血液。收获组织并在液氮中快速冷冻并储存在  $-70^{\circ}\text{C}$  或固定在福尔马林中并包埋在石蜡中。

#### 大鼠

使用雄性 OLETF ( $n = 11$ ) 和年龄匹配的 LETO 大鼠 ( $n = 3$ )，并且在具有 12 小时光/暗循环的无特定病原体的设施中进行实验。OLETF 大鼠是代表迟发性高血糖症的模型，并且表现出慢性病程，轻度肥胖和糖尿病的临床发作。动物可以不受限制地获取水和食物。在 12 周龄时，将大鼠随机化并通过胃管饲法用 PBS 或依泽替米贝 ( $10\text{mg}/\text{kg}/\text{天}$ ) 处理 20 周。在研究结束时，将大鼠禁食过夜并用腹腔内 Zoletil / Rompun 麻醉。从腹主动脉收集血液，解剖肝组织，立即在液氮中冷冻，并储存在  $-80^{\circ}\text{C}$  直至进一步分析。

#### 【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。