

## Abiraterone ; 阿比特龙

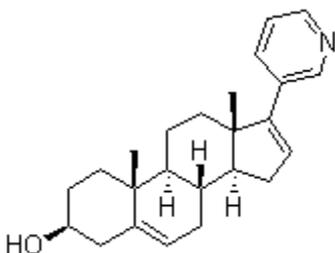
产品编号：MB2052

质量标准：>98%,细胞色素 CYP17 抑制剂

包装规格：100MG;1G

产品形式：powder

### 基本信息

|               |                               |     |   |
|---------------|-------------------------------|-----|---|
| 分子式           | C24H31NO                      | 结构式 |  |
| 分子量           | 349.51                        |     |   |
| CAS No.       | 154229-19-3                   |     |   |
| 储存条件          | 2-8°C，避光防潮密闭干燥                |     |   |
| 溶解性<br>(25°C) | DMSO : 0.1 mg/mL (0.28 mM)    |     |   |
|               | DMF 4 mg/mL warmed (11.44 mM) |     |   |
|               | Ethanol : 0.2 mg/mL (0.57 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：**阿比特龙 Abiraterone 是一种有效的选择性的不可逆 **CYP17** 抑制剂，**IC<sub>50</sub>** 为 2 到 4 nM。

**别名：**阿比特龙;坦度酮罗;阿比特伦; 17-(3-Pyridyl)androsta-5,16-dien-3beta-ol ; CB-7598

### 物理性状及指标：

外观：.....灰白色固体

溶解性：.....DMSO : 0.1 mg/mL (0.28 mM) ; DMF 4 mg/mL warmed (11.44 mM) ; Ethanol : 0.2 mg/mL (0.57 mM)

含量：.....>98%

**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> | Abiraterone 是一种有效 CYP17 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 2 nM。   |
| <b>特性</b>   | Abiraterone 已经批准用于治疗 Docetaxel 处理的阉割性前列腺癌(CRPC)。  |
| <b>靶点</b>   | CYP17 (Cell-free assay)<br>2 nM   |
| <b>体外研究</b> | Abiraterone 与野生型和突变型雄激素受体(AR)结合。在体外，Abiraterone 抑制增殖和雄激素受体调节的雄激素受体阳性前列腺癌细胞基因表达，可通过抑制类固醇和抗雄激素受体来解释机制。事实上，Eplerenone 激活的突变型雄激素受体可被更高浓度 Abiraterone 抑制。Abiraterone 取代 WT-AR 和 T877A 中的配体，EC50 分别为 13.4 μM 和 7.9 μM。Abiraterone 作用于大鼠睾丸微粒，抑制裂解酶活性,IC50 为 5.8 nM。Abiraterone 醋酸盐显著抑制 T 分泌(-48%)，且反过来提高 LH 浓度。(192%)。 |
| <b>体内研究</b> | 在人类睾丸微粒体中，Abiraterone 抑制 CYP17，IC50 为 72 nM。Abiraterone 不能显著降低任何器官尺寸。Abiraterone 强烈降低睾丸激素水平，几乎达到切除睾丸的水平。与对照组相比，Abiraterone 降低 95%以上睾丸激素水平。  |

### 美仑相关产品推荐

|        |                     |
|--------|---------------------|
| MB2062 | Abiraterone Acetate |
|--------|---------------------|

**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。Abiraterone (CB-7598, CB7598, CB7598)是一种有效的甾体细胞色素 P450 17 $\alpha$ -羟化-17,20 裂解酶(CYP17)抑制剂。阿比特龙可用于前列腺癌的治疗。

**储液配置**

| 体 积<br>浓度 | 质 量<br>积 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|-----------|----------|-----------|------------|------------|
| 1 mM      |          | 2.8611 mL | 14.3057 mL | 28.6115 mL |
| 5 mM      |          | 0.5722 mL | 2.8611 mL  | 5.7223 mL  |
| 10 mM     |          | 0.2861 mL | 1.4306 mL  | 2.8611 mL  |
| 50 mM     |          | -         | -          | -          |

**经典实验操作 (仅供参考)**

|              |  |
|--------------|--|
| <b>激酶实验:</b> | <p><b>C<sub>17,20</sub>-裂解酶活性实验:</b><br/>在含 0.25 M 蔗糖, 20 mM Tris-HCl (pH 7.4), 10 mM G6P 和 1.2 IU/mL G6PDH 的反应混合物中, 微粒体稀释到终蛋白浓度为 50 <math>\mu</math>g/mL。在 37°C 下平衡 10 分钟后, 加入 <math>\beta</math>NADP 开始反应 终浓度为 0.6 mM。在分配 600 <math>\mu</math>L 反应物到每个试管前, 在氮气流下蒸发 Abiraterone 到干燥状, 然后在 37°C 下温育 10 分钟。与 Abiraterone 温育后, 500 <math>\mu</math>L 反应混合物转移到含 1 <math>\mu</math>M 酶底物, 17OHP 的试管中。再温育 10 分钟后, 试管置于冰上, 加入 0.1 ml NaOH 1N 终止反应。试管速冻, 然后储存于 -20°C 下, 直到用于 <math>\Delta</math>4A 水平测定。进行 <math>\Delta</math>4A RIA, 然后在微孔板格式上使用抗 <math>\Delta</math>4A 的特异性抗体进行自动化。使用葡聚糖被覆活性炭悬浮法实现游离态抗原和结合态抗原的分离。离心后, 在 1450 MicrobetaPlus 配体闪烁计数器中重复测量等分上清液。从标准曲线中测定未知样本中 <math>\Delta</math>4A 浓度。使用非线性分析计算 IC50 值。</p> |
| <b>细胞实验:</b> | <p><b>Cell lines:</b> LNCaP 和 VCaP 细胞<br/><b>Concentrations:</b> 0.1 <math>\mu</math>M, 1 <math>\mu</math>M, 或 5 <math>\mu</math>M<br/><b>Incubation Time:</b> 24 小时或 96 小时<br/><b>Method:</b> LNCaP 和 VCaP 细胞接种在 96 孔板上, 在补充 CSS 的无酚红培养基或补充 FBS 的培养基中生长 7 天。接种后 24 小时和 96 小时分别使用 Abiraterone 处理细胞, 在第 7 天加入 CellTiter Glo 测定细胞活性和测量发光。</p>  |
| <b>动物实验:</b> | <p><b>Animal Models:</b> LAPC-4 移植瘤小鼠<br/><b>Formulation:</b> 0.3% 羟丙基纤维素<br/><b>Dosages:</b> 0.15 mmol/kg<br/><b>Administration:</b> 皮下注射</p>   |

**【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。