

## Abiraterone Acetate ; 乙酸阿比特龙酯

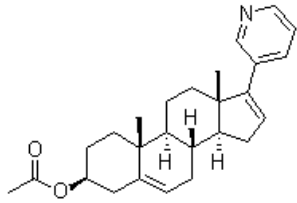
产品编号：MB2062

质量标准：>98%,细胞色素 CYP17 抑制剂

包装规格：100MG;1G;5G

产品形式：白色或类白色粉末

### 基本信息

分子式	C26H33NO2	结构式	
分子量	391.55		
CAS No.	154229-18-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : Insoluble Water Insoluble Ethanol : 28 mg/mL (71.51 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：**Abiraterone acetate 是一种口服有效的选择性的不可逆的 CYP17 抑制剂。

**别名：**CB7630 ; 17-(Pyridin-3-yl)androsta-5,16-dien-3β-yl acetate, CB 7598

### 物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

熔点：.....127-130°C

溶解性：.....DMSO : Insoluble ; Water Insoluble ; Ethanol : 28 mg/mL (71.51 mM)

密度：.....~1.1 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....>98%

IC50 : .....17,20 裂解酶活性：IC50 = 17 nM; 17α-羟化酶活性：IC50 = 18 nM

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Abiraterone Acetate 是 Abiraterone 的醋酸盐形式，是一种甾体类细胞色素 <b>CYP17</b> 抑制剂，无细胞试验中 <b>IC50</b> 为 72 nM。		
<b>特性</b>	Abiraterone 是一种用于去雄抗性的前列腺癌药物。		
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>CYP17 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>72 nM</td> </tr> </table>	CYP17 (Cell-free assay)	72 nM
CYP17 (Cell-free assay)			
72 nM			
<b>体外研究</b>	Abiraterone 仅在 SM1 中表现出与血红素铁良好的络合作用。Abiraterone 通过抑制 CYP17A1，阻断雄激素的合成。Abiraterone 也会阻断 3β-羟化类固醇脱氢酶(3βHSD)，3βHSD 是一种完全依赖生物活性雄激素合成的酶。Abiraterone 抑制 DHEA 转化为 Δ <sup>4</sup> -雄烯		

	<p>二酮。Abiraterone 对 3<math>\beta</math>HSD 的抑制阻断 DHT 合成和雄激素受体响应。Abiraterone 抑制 <math>\Delta^5</math>-雄烯二醇转化为睾酮。Abiraterone 抑制 C<sub>17,20</sub>-裂解酶,在大鼠睾丸微粒体中 IC<sub>50</sub> 为 5.8 nM。Abiraterone 显著抑制睾酮分泌(-48%),并反过来增加 LH 浓度(192%)。Abiraterone 抑制 AR-阳性前列腺癌细胞的体外增殖和 AR 调控基因的表达,这可能是除了类固醇生成抑制作用外的 AR 拮抗作用造成的。</p>
<b>体内研究</b>	<p>对大鼠进行腹腔注射给药, abiraterone 在体内快速脱乙酰化。CB7630 ( Abiraterone Acetate ) 是去醋酸盐前体药物,它能够抑制循环中的睾酮至检测水平以下,并显著降低雄激素敏感器官的重量。Abiraterone 耐受良好,平均消除半衰期为 27.6 小时。在小鼠中进行的临床前研究表明, abiraterone 抑制 CYP17, 降低雄激素的产生,可导致前列腺、睾丸和精囊的体重减少。</p>

**美仑相关产品推荐**

MB2052	Abiraterone
--------	-------------

**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。醋酸阿比特龙在体内被转化为阿比特龙, 一种雄激素生物合成抑制剂, 抑制 17 $\alpha$ -羟化酶/C17,20-裂解酶(CYP17)。在睾丸, 肾上腺, 和前列腺肿瘤组织中表达此酶和为雄激素生物合成所需。

**储液配置**

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5540 mL	12.7698 mL	25.5395 mL
5 mM	0.5108 mL	2.5540 mL	5.1079 mL
10 mM	0.2554 mL	1.2770 mL	2.5540 mL
50 mM	0.0511 mL	0.2554 mL	0.5108 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验:</b>	<p>C17,20-裂解酶活性试验:                  将微粒体在反应混合物中稀释至终蛋白浓度为 50 <math>\mu</math>g/mL, 反应混合物包含 0.25 M 蔗糖, 20 mM Tris-HCl (pH 7.4), 10 mM G6P 和 1.2 IU/mL G6PDH。在 37 <math>^{\circ}</math>C 下平衡 10 分钟后, 加入终浓度为 0.6 mM 的 <math>\beta</math>NADP 起始反应。在将 600 <math>\mu</math>L 反应混合物分配到各试管之前, 测试化合物在氮气流中蒸干, 然后在 37 <math>^{\circ}</math>C 下培养 10 分钟。与 Abiraterone 培养后, 将 500 <math>\mu</math>L 反应混合物转移到包含 1 <math>\mu</math>M 酶底物, 17OHP 的试管中。进一步培养 10 分钟后, 试管放置在冰上, 加入 0.1 ml NaOH 1N 停止反应。将试管深度冷冻, 并储存在 -20 <math>^{\circ}</math>C, 直到测试进行到 <math>\Delta</math>4A 水平。开发 <math>\Delta</math>4A RIA, 并且使用 <math>\Delta</math>4A 的特异性抗体在实验室微孔板上自动化, 指令由 Biogenesis 提供。游离和结合抗原的分离通过葡聚糖包被的活性炭悬浮液实现。离心分离后, 等分上清液以一式两份在液体闪烁计数器上计数。未知样品的 <math>\Delta</math>4A 浓度根据标准曲线测定。检出限为 0.5 ng/mL, 在 13 ng/mL 试验值处, 试验内和试验之间的变异系数分别为 10.7 和 17.6%。酶促反应表示为每 10 分钟和每毫克蛋白质 <math>\Delta</math>4A 形成的 pmol 量。没有抑制剂(对照组)的最大活性值设定为 100%。IC<sub>50</sub> 值使用酶活性(%)对抑制剂浓度对数图的非线性分析计算。</p>
<b>细胞实验:</b>	<p>Cell lines: LNCaP 和 VCaP 细胞                  Concentrations: 0 <math>\mu</math>M -10 <math>\mu</math>M</p>

	Incubation Time: 24 小时和 96 小时 Method: LNCaP 和 VcaP 细胞接种在 96 孔板 在 CSS 增补的无酚红或 FBS 增补的培养基中培养 7 天。 在接种 24 小时和 96 小时后 细胞用 Abiraterone 处理 细胞活性在第 7 天通过加入 CellTiter Glo 测量发光情况测定。
<b>动物实验：</b>	Animal Models: 负荷 LAPC4 细胞的雄性 NOD/SCID 小鼠 Formulation: 0.1 mL 5% 苜醇和 95% 红花油溶液 Dosages: 0.5 mmol/kg/d Administration: 皮下注射给药

**【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。