

Enalaprilat Dihydrate ; 依那普利拉

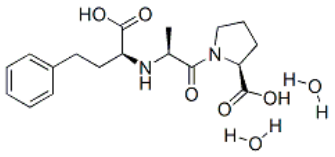
产品编号：MB3423

质量标准：>99%,ACE 抑制剂

包装规格：20MG;100MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C18H24N2O5 · 2H2O	结构式	
分子量	384.42		
CAS No.	84680-54-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 70 mg/mL (200.91 mM) Water : Insoluble Ethanol 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：依那普利拉二水合物 Enalaprilat 是血管紧张素转化酶 (ACE) 抑制剂，IC50 为 1.94 nM。

别名：(2S)-1-[(2S)-2-[[[(1S)-1-Carboxy-3-phenyl-propyl]amino]propanoyl]pyrrolidine-2-carboxylic acid, Vasotec

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 70 mg/mL (200.91 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Enalaprilat Dihydrate 是一种新型血管紧张肽转化酶(ACE)抑制剂，IC50 为 1.2 nM。
特性	Enalapril 是第一个含二甲酸乙基酯的 ACE 抑制剂。研发 Enalapril 是为了和 captopril 作比较。
靶点	ACE 1.94 nM
体外研究	Enalaprilat 是 Enalapril 的二价酸代谢物，口服没有生物活性，必须静脉注射处理。表达 B1R-YFP 的 HEK 293 细胞对 Enalaprilat 激活的磷脂酶 A2 没有反应，而对 Lys-des-Arg9-BK 反应很强烈。放射性标记的 Enalaprilat 不会结合到表达重组人类 B1R 的细胞中，但是高特异性结合到人类脐静脉内皮细胞重组 ACE (0.25-10 nM) 或正常表达的 ACE 上(KD=0.23 nM)。Enalaprilat 作用于表达 B1Rs 的 HEK 293a 细胞，不会刺激钙信号通路。体外研究显示 Enalaprilat 有效抑制脑 ACE，而 enalapril 抑制效果则很弱。
体内研究	Enalapril 作用于自发性高血压鼠，对组织(血清,肾,脑,和主动脉)产生明显的 ACE 抑制效果。体内,血清中活性代谢产物 Enalaprilat 的吸收导致 enalapril 抑制主动脉 ACE 活性。Enalaprilat 激活

B1 受体和刺激肾脏中产生 NO，促进血管舒张。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1527	Captopril
MB1527-S	Captopril (标准品)
MB25028	卡托普利-d3

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。依那普利是血管紧张素转换酶(ACE)的抑制剂，抗高血压，和缓激肽 B1 受体激活剂。Enalaprilat 与 ACE 具有 nM 效价并激活 B1 受体释放 NO。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8703 mL	14.3513 mL	28.7026 mL
5 mM	0.5741 mL	2.8703 mL	5.7405 mL
10 mM	0.2870 mL	1.4351 mL	2.8703 mL
50 mM	0.0574 mL	0.2870 mL	0.5741 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>激酶实验: Enalaprilat 溶解在 0.05 M 硼酸盐-磷酸盐 buffer 中, pH 为 8.0,浓度为 5×10^{-3} M; 溶解在 NaCl, 浓度为 0.17 M。用这种 buffer 再配制稀释液。100 μL 每种 3.7×10^{-4} M 底物溶液 Cbz-Phe-His-14C-Leu]-OH, 每管 5.5×10^4 c.p.m, 和转换酶稀释液, 加到 100 μL of Enalaprilat 溶液中, 温育后, 从上清液中获得约 1.2×10^4 c.p.m.。底物最终浓度为 1.2×10^{-4} M。K_m值为 $1-2 \times 10^{-4}$ M。反应在 30°C 下温育 1 小时, 然后加入 1 mL 溶于 0.05 M 硼酸盐 buffer 的苯甲酰化 DEAE (BD)纤维素 40%悬浮液, pH 为 11, 或者溶于 0.05 M 硼酸盐 buffer 的 20% BD Sephadex, pH 为 7.7, 终止反应。没处理的底物结合到 BD 上, 通过 cotton-plugged Sarpette(尺寸 102/2)过滤, 从上清液分离。全部的上清液和冲洗 BD 残渣的 0.5mL buffer 收集在闪烁瓶中。在 10 mL PCS 计数 10 分钟。测定 IC50 值。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: Rat cardiac fibroblasts cell lines Concentrations: Dissolved in DMSO, final concentrations 1 nM - 10 μM Incubation Time: 24 hours Method: After 24 hours incubation in serum-free medium (DMEM), cells are stimulated with IGF-I (1-100 nM) and coincubated with Enalaprilat (1 nM-10 μM) for 24 hours. Cellular proliferation is assessed by 5-bromo-2'-deoxyuridine (BrdU) incorporation during the last 4 hours of the 24 hours incubation period using a colorimetric immunoassay. The extinctions are measured at 450 nm in an ELISA plate reader. All values consist of an n=9.</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 20-24 周大的雄性自发性高血压鼠 Formulation: 溶于盐水中 Dosages: 0.01, 0.03 和 0.1 mg/kg.</p>

	Administration: 静脉注射处理
--	-------------------------------

【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。