

LXR-623 (WAY-252623) ; WAY-252623 ; LXR623

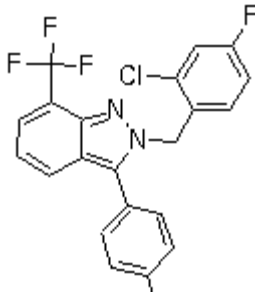
产品编号：MB3471

质量标准：>98%,LXR 激动剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C21H12ClF5N2	结 构 式	
分子量	422.78		
CAS No.	875787-07-8		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 84 mg/mL (198.68 mM) Water : Insoluble Ethanol : 84 mg/mL warmed (198.68 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 :LXR-623 是有效透过血脑屏障的 LXR 激动剂 ,对 LXR-β 和 LXR-α 的 IC₅₀ 值分别为 179 和 24 nM。

别名 : 2-[(2-Chloro-4-fluorophenyl)methyl]-3-(4-fluorophenyl)-7-(trifluoromethyl)indazole, CID 16734800, LXR-623, LXR623

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 84 mg/mL (198.68 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 84 mg/mL warmed (198.68 mM)

含量：.....>98%

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	LXR-623 是一种新型的 liver X-receptor(LXR)激动剂，对 LXR-α 和 LXR-β 的 IC ₅₀ 值分别为 179 nM 和 24 nM。它具有生物口服活性并能通过血脑屏障。
靶点	LXR-β LXR-α 24 nM 179 nM
体外研究	LXR-623 抑制 LDLR 表达，增加 ABCA1 外流性转运蛋白的表达并诱导 GBM 细胞的大幅度细胞死亡。脑转移性乳腺癌细胞 MDA-MB-361 对 LXR-623 依赖性细胞死亡高度敏感。在 GBM 细胞中，LXR-623 抑制 LDL 吸收并诱导胆固醇外流，导致细胞内胆固醇含量显著降低。正常脑细胞对 LXR-623 不敏感，可能是由于正常细胞依赖于内源性胆固醇合成、通过合成羟固醇维持完整的负反馈效应。
体内研究	LXR-623 在体内可被迅速吸收，峰浓度 (C _{max}) 出现在给药后约 2 小时。C _{max} 和浓度时间曲线下面积成剂量成正比关系。平均半衰期为 41-43 小时。在 LDLr 敲除的动脉粥样硬化的小鼠模型中，口服以 LXR-623 能上调其肠道 ABCG5 和 ABCG8 表达、减少动脉粥样硬化的负担，而不影响血清或肝脏胆固醇和甘油三酯。在具有恶性胶质瘤的小鼠中，LXR-623 具有大脑渗透性并导致肿瘤消退，降低胆固醇水平并诱导细胞死亡。

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)

MB3472	GW3965 HCl
MB3478	T0901317

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。WAY-252623 (LXR623) 是一种口服、有效、高选择性的肝 X 受体激动剂(LXRs), 可显著降低总胆固醇和 ldl -胆固醇。WAY-252623 可降低小鼠 LDLR(-/-)动脉粥样硬化模型的病变进展。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3653 mL	11.8265 mL	23.6530 mL
5 mM	0.4731 mL	2.3653 mL	4.7306 mL
10 mM	0.2365 mL	1.1826 mL	2.3653 mL
50 mM	0.0473 mL	0.2365 mL	0.4731 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验 :	<p>Cell lines: Human PBMC</p> <p>Concentrations: 2 μM</p> <p>Incubation Time: 18 h</p> <p>Method: 将纯化的 PBMC 重悬与培养基中(RPMI + 10% FBS + 1% penicillin/streptomycin + 1% L-glutamine), 然后将其转移至 6 孔板中, 细胞密度为 5×10^6个/孔, 加入 2 μM LXR-623 或 vehicle(DMSO). 培养 18 小时后, 提取 RNA 并进行 qPCR 分析, 分析 LXRα, LXRβ, ABCA1, ABCG1, PLTP 的表达。</p>
动物实验 :	<p>Animal Models: C57/Bl6 小鼠</p> <p>Formulation: 0.1% DMSO</p> <p>Dosages: 30 mg/kg</p> <p>Administration: 口服</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。