

## MK-0752

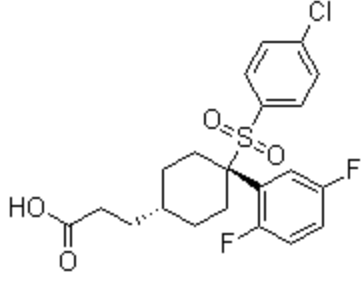
产品编号：MB3695

质量标准：>98%， $\gamma$ -secretase 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：粉状

### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> ClF <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	结构式	
分子量	442.9		
CAS No.	471905-41-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 89 mg/mL (200.94 mM) Water Insoluble Ethanol : 45 mg/mL (101.6 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：** MK-0752 是一种适度有效的  $\gamma$ -secretase ( $\gamma$ -分泌酶) 抑制剂，在阿尔茨海默病的治疗中很有用。

**别名：** 3-((1r,4s)-4-(4-chlorophenylsulfonyl)-4-(2,5-difluorophenyl)cyclohexyl)propanoic acid

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 89 mg/mL (200.94 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 45 mg/mL (101.6 mM)

含量：.....>98%

**储存条件：** -20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	MK-0752 是一种适度有效的 $\gamma$ -secretase ( $\gamma$ -分泌酶) 抑制剂，降低 A $\beta$ 40 产量，IC <sub>50</sub> 为 5 nM。	
<b>特性</b>	一种适度有效的 $\gamma$ -分泌酶抑制剂。	
<b>靶点</b>	$\gamma$ secretase(A $\beta$ 40)	A $\beta$ (in human SH-SY5Y cells)  5 nM
<b>体外研究</b>	MK-0752 是一种适度有效的 $\gamma$ -分泌抑制剂，其剂量依赖性减少人 SH-SY5Y 细胞中 A $\beta$ 40，IC <sub>50</sub> 为 5 nM。在体外，MK-0752 阻断凹槽胞内结构域(ICD)裂解，以及随后的核易位。	
<b>体内研究</b>	在猕猴大脑中，MK-0752(240 mg/kg)使新产生的 A $\beta$ 生成减少，AUV 下降 90%。此外，MK-0752 治疗增加 A $\beta$ 1-14，A $\beta$ 1-15，和 A $\beta$ 1-16 水平，而减少 A $\beta$ 1-17 水平。在豚鼠体内，MK-0752 (10 mg/kg -30 mg/kg)口服给药导致 A $\beta$ 40 在血浆，大脑和脑脊液(CSF)中剂量依赖性减少，在大脑中 IC <sub>50</sub> 为 440 nM。	

**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)**

MB5152	DAPT (GSI-IX)
--------	---------------

MB3697	LY411575
MB3694	Semagacestat (LY450139)
MB3696	YO-01027 (Dibenzazepine)

**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。mk - 0752 是一个强有力的 $\gamma$ 分泌酶( $\gamma$ -secretase)抑制剂。MK-0752 在阿尔茨海默病的治疗中很有用。

**储液配置**

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2578 mL	11.2892 mL	22.5785 mL
5 mM	0.4516 mL	2.2578 mL	4.5157 mL
10 mM	0.2258 mL	1.1289 mL	2.2578 mL
50 mM	0.0452 mL	0.2258 mL	0.4516 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>动物实验：</b>	Animal Models: 小脑延髓池移植的(CMP)猕猴模型。 Formulation: MK-0752 在水中溶解。 Dosages: $\leq 240$ mg/kg Administration: p.o.
--------------	---

**【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。