

MK-886 ; L-663,536

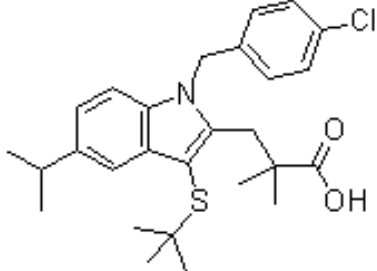
产品编号 : MB4248

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₇ H ₃₄ ClNO ₂ S	结 构 式	
分子量	472.08		
CAS No.	118414-82-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 94 mg/mL (199.11 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 : MK-886 是白三烯生物合成的抑制剂, 抑制 5-脂氧合酶激活蛋白 (FLAP)。它同时还是 PPAR α 拮抗剂。

别名 : L 663536 ; 1H-Indole-2-propanoic acid, 1-[(4-chlorophenyl)methyl]-3-[(1,1-dimethylethyl)thio]- α,α -dimethyl-5-(1-methylethyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 94 mg/mL (199.11 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	MK-886 是白三烯生物合成的抑制剂, 抑制 5-脂氧合酶激活蛋白 (FLAP)。它同时还是 PPAR α 拮抗剂。		
靶点	5-lipoxygenase-activating protein (FLAP)	PPAR α	COX-1 COX-2
			8 μ M 58 μ M

体外研究	MK-886, 脂氧合酶激活蛋白 (FLAP) 抑制剂, 在完整细胞中能有效抑制白三烯生物合成。在炎症反应、过敏反应、癌症和心血管疾病的细胞模型和动物模型中, MK-886 经常被用于鉴定 5-脂氧合酶途径的作用。MK-886 抑制 COX-1 (IC50=8 μM), 并在人类血小板响应胶原和外源性花生四烯酸时, 阻止 COX-1 衍生物 12-HHT 和血栓素 B2 的形成 (IC50=13-15 μM), 而对 COX-2 的影响比较小 (IC50=58 μM)。在 A549 细胞中, MK-886(33 μM)不能抑制 COX2 依赖性的 6-ketoprostaglandin (PG)F1α的形成。MK-886(10 μM) 能抑制在胶原和花生四烯酸诱导后 COX-1 所介导的血小板凝集, 而不影响凝血酶、U-46619 所诱导的凝集。
体内研究	向小鼠腹腔中每天重复注射 MK-886, 其前额皮质的大脑组织中的 GluR1 磷酸化升高。相反地, 单次注射 MK-886 并不影响皮质 GluR1 磷酸化。

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-886 是白三烯生物合成的抑制剂, 抑制 5-脂氧合酶激活蛋白 (FLAP)。它同时还是 PPARα拮抗剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1183 mL	10.5914 mL
5 mM	0.4237 mL	2.1183 mL	4.2366 mL	
10 mM	0.2118 mL	1.0591 mL	2.1183 mL	
50 mM	0.0424 mL	0.2118 mL	0.4237 mL	

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: A549 细胞</p> <p>Concentrations: 33 μM</p> <p>Incubation Time: 15 min</p> <p>Method:</p> <p>用 33 μM MK-886、10 μM indomethacin、5 μM celecoxib 以及 DMSO 预先处理 IL-1β 刺激过的 A549 细胞 15 分钟。然后加入 30 μM 花生四烯酸, 37°C 孵育 15 分钟后, 通过 ELISA 检测所释放的 6-keto PGF1α量。</p>
动物实验	<p>Animal Models: C57BL/6J 雄性小鼠</p> <p>Formulation: 5%二甲亚砜 (溶于生理盐水)</p> <p>Dosages: 3 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。