

Dalcetrapib (JTT705, RO4607381) ; 达塞曲匹

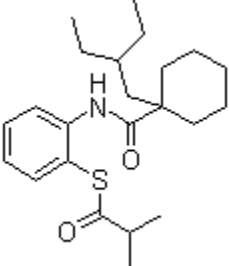
产品编号 : MB4302

质量标准 : >98%

包装规格 : 5MG;10MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H35NO2S	结 构 式	
分子量	389.59		
CAS No.	211513-37-0		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 78 mg/mL (200.21 mM) Water Insoluble Ethanol : 78 mg/mL (200.21 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 : Dalcetrapib (JTT-705; RO-4607381)是 rhCETP 抑制剂, 能增加血浆中 HDL 胆固醇。

别名 : 达塞曲匹 ; JTT-705; RO4607381 ; Propanethioic acid, 2-methyl-, S-[2-[[[1-(2-ethylbutyl)cyclohexyl]carbonyl]amino]phenyl] ester

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 78 mg/mL (200.21 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 78 mg/mL (200.21 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	达塞曲匹是 rhCETP 抑制剂, IC50 为 0.2 μM, 提高血浆中高密度脂蛋白 (HDL) 胆固醇。
靶点	CETP
IC50	0.2 μM

体外研究	Dalcetrapib 调节胆固醇酯转运蛋白活性。在人血浆中加入 Dalcetrapib 可诱导胆固醇酯转运蛋白构象变化。人血浆中 CETP 诱导的前 β -高密度脂蛋白在 Dalcetrapib 低于 $3\mu\text{M}$ 是浓度不变但在其 $10\mu\text{M}$ 时增加。Dalcetrapib 可显著增加前 β -高密度脂蛋白的形成。在人血浆中 Dalcetrapib 在浓度为 $9\mu\text{M}$ 可抑制胆固醇酯转运蛋白 50% 活。Dalcetrapib 可在 Hep G2 细胞中抑制胆固醇酯转运蛋白活性，该抑制作用具剂量依赖性
体内研究	Dalcetrapib 处理显著增加高密度脂蛋白胆固醇水平。在注射 $[3\text{H}]$ cholesterol 标记的自体巨噬细胞的仓鼠模型中，Dalcetrapib 可显著增加粪消除中 $[3\text{H}]$ 中性固醇和 $[3\text{H}]$ 胆汁酸。Dalcetrapib 增加血浆高密度脂蛋白- $[3\text{H}]$ 胆固醇。Dalcetrapib 在雄性日本白兔模型中以口服 30mg/kg 剂量可抑制胆固醇酯转运蛋白 95% 活性。Dalcetrapib 分别增加血浆高密度脂蛋白胆固醇水平 27% 和 54%。雄性日本白兔口服剂量 30mg/kg 或 100mg/kg 每日 3 次可显著增加血清中高密度脂蛋白胆固醇。Dalcetrapib 可显著增加 HDL-C 水平。Dalcetrapib 处理兔 5 和 7 月后，和对照组相比，HDL 2-C 比 HDL 3-C 比例明显增加，表明 Dalcetrapib 对胆固醇酯转运蛋白活性的抑制影响了高密度脂蛋白亚组分的变化并优先增加 HDL 2C 含量。Dalcetrapib 治疗增加血清酯酶活性和高密度脂蛋白相关的血小板活化因子乙酰水解酶活性，但可降低血浆溶血磷脂酰胆碱浓度。

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)

MB4303	Evacetrapib (LY2484595)
--------	-------------------------

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。本品是 rhCETP 抑制剂，能增加血浆中 HDL 胆固醇。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	2.5668 mL	12.8340 mL	25.6680 mL
5 mM	0.5134 mL	2.5668 mL	5.1336 mL
10 mM	0.2567 mL	1.2834 mL	2.5668 mL
50 mM	0.0513 mL	0.2567 mL	0.5134 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>抑制 rhCETP 和 C13S CETP 介导的从 HDL 到 LDL 的 CE 转移:</p> <p>Dalcetrapib 的 IC 50 可降低 rhCETP 和 C13S CETP 介导由 HDL 向 LDL 的 CE 转移。测量使用闪烁接近法试剂盒。简单地说，$[3\text{H}]$ CE 包被的 HDL 供体粒子、纯化的胆固醇酯转运蛋白（终浓度 $0.5\mu\text{g/mL}$）和生物素标记的低密度脂蛋白受体粒子于 37°C 共培养 3 小时。随后，添加链霉亲和素偶联多聚甲基丙烯酸酯珠在含液体闪烁溶液中，选择性结合生物素标记的低密度脂蛋白，用 β</p>
-------------	---

	计数测量 ^[3H] CE 分子到 LDL 的转移量。
细胞实验	Cell lines: HepG2 细胞系 Concentrations: 0 μM–30 Mm Incubation Time: 24 小时 Method: 肝癌 HepG2 细胞铺板于 6 孔板培养至 70–80%汇合。用 PBS 洗后，细胞用含不同浓度 (0μM–30μM，溶解于 2%二甲基亚砷) 的化学抑制剂 Dalcetrapib 处理 24 小时。制备用于 RT - PCR 检测的总 RNA。
动物实验	Animal Models: 四周雄性仓鼠 Formulation: 0.5% 甲基纤维素 Dosages: 100 mg/kg Administration: 口服灌胃

【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。