

Darapladib (SB-480848) ; 达普拉缔

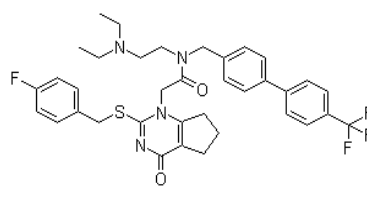
产品编号 : MB4320

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C36H38F4N4O2S	结 构 式	
分子量	666.77		
CAS No.	356057-34-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL warmed (149.97 mM) Water : Insoluble Ethanol : 100 mg/mL (149.97 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 : Darapladib 是一种有效的脂蛋白相关磷脂酶 A2 (Lp-PLA2) 抑制剂。

别名 : 达拉地 ; SB-480848 ; N-[2-(Diethylamino)ethyl]-N-[4'-(trifluoromethyl)-1,1'-biphenyl-4-ylmethyl]-2-[2-(4-fluorobenzylthio)-4-oxo-4,5,6,7-tetrahydro-1H-cyclopenta[d]pyrimidin-1-yl]acetamide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL warmed (149.97 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 100 mg/mL (149.97 mM)

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	Darapladib (SB-480848)是不可逆的 lipoprotein-associated phospholipase A2 (Lp-PLA2) 抑制剂, 其 IC50 为 0.25 nM。 Phase 3。
靶点	Lp-PLA2 (Cell-free assay)

	0.25 nM
体外研究	铜催化的人 LDL 氧化期间, Darapladib 防止产生 lyso-PtdCho 和随后的单核细胞趋化性, IC50 为 4 nM。
体内研究	在 WHHL 兔子体内, Darapladib (30 毫克/千克, 口服)表现出对 95%动脉粥样硬化的 Lp-PLA2 良好的抑制作用。Darapladib, 作为 Lp-PLA 的抑制剂, 减弱患有糖尿病和高胆固醇血症 (DMHC) 猪的晚期冠状动脉粥样硬化。在 DMHC 猪体内, darapladib 减少 IgG 免疫阳性物质渗透到大脑的量, 并降低含有 A β 42 神经元的密度。

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)

MB1920	Clofazimine
MB11532	蜂毒素(Melittin)
MB4317	卤倍他素丙酸酯

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。Darapladib 是一种有效的脂蛋白相关磷脂酶 A2 (Lp-PLA2) 抑制剂。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	1.4998 mL	7.4988 mL	14.9977 mL
5 mM	0.3000 mL	1.4998 mL	2.9995 mL
10 mM	0.1500 mL	0.7499 mL	1.4998 mL
50 mM	0.0300 mL	0.1500 mL	0.3000 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: WHHL 兔子 Formulation: 1%甲基纤维素溶液 Dosages: ~30 毫克/千克 Administration: 口服
-------------	--

【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。