

## MK8245 ; MK-8245

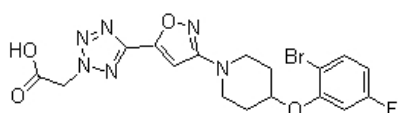
产品编号 : MB4345

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG ; 10MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C17H16BrFN6O4	结 构 式	
分子量	467.25		
CAS No.	1030612-90-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 93 mg/mL (199.03 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-8245 是肝靶向的硬脂酰-CoA 去饱和酶 ( SCD ) 抑制剂。

**别名 :** 2H-Tetrazole-2-acetic acid,

5-[3-[4-(2-bromo-5-fluorophenoxy)-1-piperidiny]-5-isoxazolyl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 93 mg/mL (199.03 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

<b>产品描述</b>	MK-8245 是一种靶向作用于肝脏的 stearoyl-CoA desaturase (SCD) ( 硬脂酰辅酶 A 去饱和酶 ) 抑制剂, 作用于人类 SCD1 时, IC50 为 1 nM, 作用于大鼠和小鼠 SCD1 时, IC50 为 3 nM, 具有抗糖尿病和抗高血脂症作用。		
<b>特性</b>	MK-8245 是有效的肝靶向 SCD 抑制剂, 与其他 SCD 抑制剂相比, 不会影响皮肤和眼睛组织中的 SCD 酶。		
<b>靶点</b>	SCD1 (human) 1 nM	SCD1 (rat) 3 nM	SCD1 (mouse) 3 nM
<b>体外研究</b>	MK-8245 是苯氧基哌啶异恶唑衍生物, 已经作为有效的肝脏 SCD 选择性抑制剂。MK-824 含有四氮唑乙酸基团, 关键功能是 OATPs 识别和肝靶向。MK-8245 作用于人类, 大鼠和小鼠 SCD1 具有相似功效, 作用于人类 SCD1, IC50 值为 1 nM, 作用于大鼠和小鼠 SCD1, IC50 值为 3 nM。MK-8245 作用于大鼠含有功能性活性 OATPs 的肝细胞实验, 显著抑制 SCD, IC50 为 68 nM, 然而作用于缺乏活性 OATPs 的 HepG2 细胞实验时, IC50 为 ~1 μM。HepG 实验中, MK-8245 作用于 Δ-5 和 Δ-6 脱饱和酶具有高度选择性。		

<b>体内研究</b>	MK-8245 口服给药小鼠,大鼠,犬和猕猴, 显示 MK-8245 主要作用部位是肝脏, 而很少作用于与潜在的不良反应相关组织。MK-8245 作用于 eDIO 鼠, 然后进行糖筛选, 提高糖清除力, ED50 为 7 mg/kg, 这样作用存在剂量依赖性。
-------------	--

**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-8245 是肝靶向的硬脂酰-CoA 去饱和酶 (SCD) 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.1402 mL	10.7009 mL
5 mM	0.4280 mL	2.1402 mL	4.2804 mL
10 mM	0.2140 mL	1.0701 mL	2.1402 mL
50 mM	0.0428 mL	0.2140 mL	0.4280 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>动物实验</b>	Animal Models: 雄性 C57/Bl6 鼠 Formulation: 悬浮于溶于盐水的 1%甲基纤维素 Dosages: ~30 mg/kg Administration: 口服处理
-------------	--

**【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。给药剂量的时候, 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。