

## DAPT (GSI-IX)

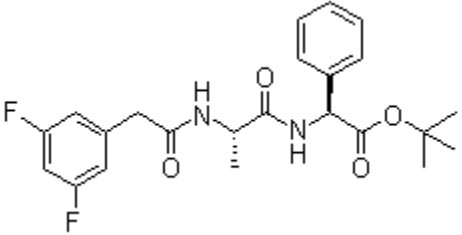
产品编号：MB5152

质量标准：>98%, $\gamma$ -secretase 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;500MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C23H26F2N2O4	结 构 式	
分子量	432.46		
CAS No.	208255-80-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 86 mg/mL (198.86 mM) Water Insoluble Ethanol : 50 mg/mL (115.61 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：**DAPT 是  $\gamma$ -分泌酶 ( $\gamma$ -secretase) 抑制剂。

**别名：**GSI-IX ; Glycine, N-[2-(3,5-difluorophenyl)acetyl]-L-alanyl-2-phenyl-, 1,1-dimethylethyl ester, (2S)-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 86 mg/mL (198.86 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 50 mg/mL (115.61 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	DAPT(GSI-IX)是新型 $\gamma$ -分泌酶抑制剂，作用于 HEK 293 细胞中全部 A $\beta$ 产量时，IC50 为 20 nM。
靶点	$\gamma$ secretase(A $\beta$ ) (HEK 293 cells)

	20 nM
<b>体外研究</b>	DAPT 功能性抑制 $\gamma$ -分泌酶而降低 HEK 293 细胞中全部 A $\beta$ 产量, IC50 为 20 nM。DAPT 作用于原代培养的人神经细胞, 也抑制 A $\beta$ 产量, 作用于全部 A $\beta$ 和 A $\beta$ 42 时, IC50 分别为 115 nM 和 200 nM, 比作用于 HEK 293 细胞时低 5-10 倍。最新研究显示 DAPT 抑制 SK-MES-1 细胞增殖, 这种作用存在浓度依赖性, IC50 为 11.265 $\mu$ M。此外, DAPT 作用于肺鳞状细胞癌细胞, 通过抑制 Notch 受体信号通路, 也诱导依赖型和非依赖型细胞凋亡。
<b>体内研究</b>	DAPT 按 100mg/kg 剂量处理 PDAPP 小鼠, 产生强劲和持久的药效, 1 小时内脑中 DAPT 水平超过 100 ng/g, 且处理后, 持续上升达 18 小时, 3 小时后的时候观察到最高水平为 490 ng/g。在此期间, DAPT 按 100 mg/kg 剂量处理, 也降低大脑皮层全部 A $\beta$ 和 A $\beta$ 42, 这种作用存在剂量依赖性, 降低 50%。DAPT 按 40 mg/kg 剂量作用于大鼠大脑皮层, 抑制 LPS 诱导的 $\gamma$ 分泌酶活性, 且提高携带长期神经炎症的细胞凋亡。
<b>特征</b>	DAPT(GSI-IX)是新型 $\gamma$ -分泌酶抑制剂。

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)

MB3697	LY411575
MB3695	MK-0752
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。DAPT 是  $\gamma$ -分泌酶 ( $\gamma$ -secretase) 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	2.3124 mL	11.5618 mL	23.1235 mL
5 mM	0.4625 mL	2.3124 mL	4.6247 mL
10 mM	0.2312 mL	1.1562 mL	2.3124 mL
50 mM	0.0462 mL	0.2312 mL	0.4625 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<b>体外 A<math>\beta</math> 减少检测实验:</b> 转染 APP751(HEK 293)基因的人类胚胎肾细胞, 用于常规 A $\beta$ 减少检测。细胞接种在 96 孔板上, 在含 10%热灭活胎牛血清的 DMEM 培养基上粘附过夜。DAPT 在 DMSO 中稀释, 终浓
-------------	---

	<p>度为 0.1% DMSO。使用 DAPT 在 37°C 下预处理细胞 2 小时，吸除培养基，使用新鲜实验化合物溶液。再处理 2 小时后，抽除条件培养基，使用标准 ELISA(266-3D6)分析全部 A<math>\beta</math>。根据使用 0.1% DMSO 处理的对照组细胞，测量 A<math>\beta</math> 产量的减少，表示为抑制百分数。实验至少按 6 种剂量重复进行，得到实验数据，然后使用 XLfit 软件拟合四参数方程，测定药性。培养的人和 PDAPP 小鼠神经细胞在无血清培养基上生长，增强他们的神经元特性，其中有 90%以上神经元在实验使用前成熟。通过向每孔中加入新鲜培养基，然后在没有 DAPT 存在时，在 37°C 下温育 24 小时，收集条件培养基中得到的基底 A<math>\beta</math> 值。使用含 DAPT 的新鲜培养基，按所需浓度范围在 37°C 下再处理培养细胞 24 小时，收集条件培养基。为了测量全部 A<math>\beta</math>，使用与 HE2K 293 细胞实验相同的 ELISA(266-3D6) 分析样本。通过分开的 ELISA(21F12-3D6)，使用特定 A<math>\beta</math>42 C-端捕获抗体，进行 A<math>\beta</math>42 产量分析。测定对全部 A<math>\beta</math> 和 A<math>\beta</math>42 产量的抑制情况。绘制与 DAPT 浓度相对的抑制百分数，使用 XLfit 软件分析数据，测定药性。</p>
<p><b>细胞实验</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> SK-MES-1  <b>Concentrations:</b> 2.5 <math>\mu</math>M 到 160 <math>\mu</math>M  <b>Incubation Time:</b> 72 小时  <b>Method:</b> 细胞接种在 96 孔板上，使用 0.1% DMSO 或 DAPT (浓度为 2.5 <math>\mu</math>M-160 <math>\mu</math>M ) 处理 72 小时。使用 MTT 染料减少检测实验，稍微修正，测定细胞毒性。与 DAPT 温育后, 20 <math>\mu</math>L MTT 溶液 (5 mg/mL，溶于 PBS)加到含 180 <math>\mu</math>L 培养基的每孔中，实验板在 37 °C 下温育 4 小时，随后每孔加入 150 <math>\mu</math>L DMSO，在室温下震荡 15 分钟混合。通过酶联免疫吸附法在 490 nm 处测定吸光值。使用 <math>\alpha</math>-MEM 及等量的 MTT 溶液和溶剂，作为空白对照。使用 PROBIT 程序在 SPSS 中计算 IC50 值。</p>
<p><b>动物实验</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> 过表达淀粉样前体蛋白 APPV717F 突变型的杂合 PDAPP 转基因小鼠  <b>Formulation:</b> DAPT 溶于玉米油, 5% (v/v) 乙醇中  <b>Dosages:</b> <math>\leq</math>100 mg/kg  <b>Administration:</b> 口服处理</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，否则会影影响化合物活性，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。