

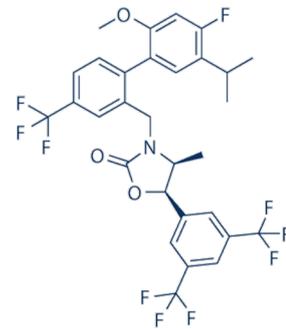
## Anacetrapib (CETP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7216-10mM	Anacetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7216-5mg	Anacetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7216-25mg	Anacetrapib (CETP抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(4S,5R)-5-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-[[2-(4-fluoro-2-methoxy-5-propan-2-ylphenyl)-5-(trifluoromethyl)phenyl]methyl]-4-methyl-1,3-oxazolidin-2-one
简称	Anacetrapib
别名	MK-0859, MK 0859, MK0859
中文名	N/A
化学式	C <sub>30</sub> H <sub>25</sub> F <sub>10</sub> NO <sub>3</sub>
分子量	637.51
CAS号	875446-37-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 127mg/ml; Ethanol 127mg/ml
溶液配制	5mg加入0.78ml DMSO, 或每6.38mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7216-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Anacetrapib (MK-0859)是一种有效的, 选择性, 可逆的rhCETP和突变CETP(C13S)抑制剂, IC50分别为7.9nM和11.8nM, 提高HDL-C, 降低LDL-C, 不提高醛固酮和血压。Phase 3。				
信号通路	Metabolism				
靶点	rhCETP	Mutant CETP (C13S)	—	—	—
IC50	7.9nM	11.8nM	—	—	—
体外研究	Anacetrapib选择性有效抑制重组人类CETP和C13S突变型CETP, IC50分别为7.9和11.8nM。Anacetrapib和抑制素一起服用时, 不仅提高HDL-胆固醇水平, 也进一步降低LDL-胆固醇水平。Anacetrapib明显降低CE从HDL3转变为HDL2, 这种作用存在剂量依赖性。Anacetrapib不影响[ <sup>14</sup> C]-dalcetrapibthiol与人类重组CETP的结合数。				
体内研究	每天, Anacetrapib按60mg/kg剂量处理异常仓鼠模型, 持续处理2周, 与对照组相比, CETP活性下降94%, HDL-胆固醇上升47%, 非HDL胆固醇浓度不受影响。此外, Anacetrapib促进巨噬细胞胆固醇逆向转运, 导致排泄物胆固醇含量上升30%。与对照组相比, Anacetrapib处理的仓鼠HDL显示SR-B1和ABCG1调节的流出物增多。按10mg/kg剂量口服处理[ <sup>14</sup> C]Anacetrapib, 48小时后, 鼠和猴分别恢复~80和90%放射性。两种动物的排泄物中放射性基本没有变化。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	通过放射性CETP转移实验, 使用2%人类血清, 测定Anacetrapib抑制CETP调节的CE和TG转移能力。过程和95%人类血清转移实验类似, 除了纯化的人类HDL(128μg/ml)和[ <sup>3</sup> H]胆甾醇油酸酯或[ <sup>3</sup> H]三油精标记的LDL。通过纯化的重组CETP(30nM)在含2%人类血清的标准CETP Buffer(50mM Tris pH为7.4, 100nM NaCl及1mM EDTA)中进行[ <sup>3</sup> H]胆甾醇油酸酯或[ <sup>3</sup> H]三油精从LDL到HDL的转变。加入1体积冰冻的人类血清和2体积20% W/V PEG 8000, 沉淀LDL, 终止转移反应。离心样本, 通过液体闪烁计数器测定等份试样中含HDL的上清液。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	成年雄性Sprague-Dawley鼠，体重为280到330克
配制	聚乙二醇300-水(7:3, v/v)
剂量	2.5ml/kg (2.5, 25, 50, 250mg/ml)
给药方式	口服饲喂

➤ **参考文献:**

- 1.Niesor EJ, et al. J Lipid Res. 2010, 51(12), 3443-3454.
- 2.Ranalletta M, et al. J Lipid Res. 2010, 51(9), 2739-2752.
- 3.Tan EY, et al. Drug Metab Dispos. 2010, 38(3), 459-473.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD7216-10mM	Anacetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7216-5mg	Anacetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7216-25mg	Anacetrapib (CETP抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01