



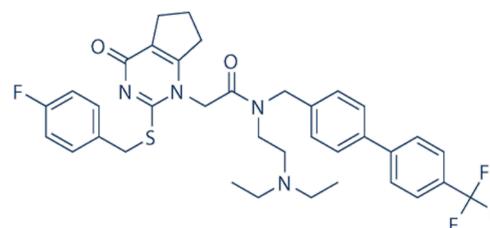
## Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7243-10mM	Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7243-5mg	Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)	5mg
SD7243-25mg	Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-[2-(diethylamino)ethyl]-2-[2-[(4-fluorophenyl)methylsulfanyl]-4-oxo-6,7-dihydro-5H-cyclopenta[d]pyrimidin-1-yl]-N-[[4-[4-(trifluoromethyl)phenyl]phenyl]methyl]acetamide
简称	Darapladib
别名	SB-480848, SB 480848, SB480848
中文名	达普拉缇
化学式	C <sub>36</sub> H <sub>38</sub> F <sub>4</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S
分子量	666.77
CAS号	356057-34-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml warming; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.75ml DMSO, 或每6.67mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7243-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Darapladib (SB-480848)是不可逆的lipoprotein-associated phospholipase A2 (Lp-PLA2)抑制剂, 其IC50为0.06nM。 Phase 3。			
信号通路	Metabolism			
靶点	Lp-PLA2	—	—	—
IC50	0.25nM	—	—	—
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4nM。			
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(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Aβ42神经元的密度。			
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	N/A

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	WHHL兔子

配制	1%甲基纤维素溶液
剂量	~30毫克/千克
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

- 1.Blackie JA, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2003, 13(6), 1067-1070.
- 2.Wilensky RL, et al. Nat Med. 2008, 14(10), 1059-1066.
- 3.Acharya NK, et al. J Alzheimers Dis. 2013, 35(1), 179-198.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD7243-10mM	Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7243-5mg	Darapladib (Lp-PLA2抑制剂)	5mg
SD7243-25mg	Darapladib (Lp-PLA2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成高浓度的储备液(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