

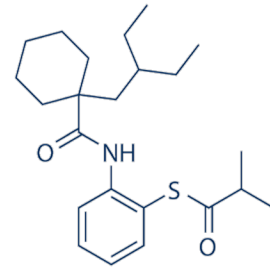
Dalcetrapib (CETP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7207-10mM	Dalcetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7207-5mg	Dalcetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7207-25mg	Dalcetrapib (CETP抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	S-[2-[[1-(2-ethylbutyl)cyclohexanecarbonyl]amino]phenyl] 2-methylpropanethioate
简称	Dalcetrapib
别名	JTT-705, JTT 705, JTT705, RO4607381, RO-4607381, RO 4607381
中文名	达塞曲匹
化学式	C ₂₃ H ₃₅ NO ₂ S
分子量	389.59
CAS号	211513-37-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 78mg/ml; Ethanol 78mg/ml
溶液配制	5mg加入1.28ml DMSO, 或每3.90mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7207-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Dalcetrapib (JTT-705, RO4607381)是一种rhCETP抑制剂, IC ₅₀ 为0.2μM, 提高血浆中高密度脂蛋白(HDL)胆固醇。Phase 3。				
信号通路	Metabolism				
靶点	rhCETP	—	—	—	—
IC ₅₀	0.2μM	—	—	—	—
体外研究	Dalcetrapib调节胆固醇酯转运蛋白活性。在人血浆中加入Dalcetrapib可诱导胆固醇酯转运蛋白构象变化。人血浆中CETP诱导的前β-高密度脂蛋白在Dalcetrapib低于3μM是浓度不变但在其为10μM时增加。Dalcetrapib可显著增加前β-高密度脂蛋白的形成。在人血浆中Dalcetrapib在浓度为9μM可抑制胆固醇酯转运蛋白50%活性。Dalcetrapib可在Hep G2细胞中抑制胆固醇酯转运蛋白活性, 该抑制作用具剂量依赖性。				
体内研究	Dalcetrapib处理显著增加高密度脂蛋白胆固醇水平。在注射 ³ H cholesterol标记的自体巨噬细胞的仓鼠模型中, Dalcetrapib可显著增加粪消除中 ³ H中性固醇和 ³ H胆汁酸。Dalcetrapib增加血浆高密度脂蛋白- ³ H胆固醇。Dalcetrapib在雄性日本白兔模型中以口服30mg/kg剂量可抑制胆固醇酯转运蛋白95%活性。Dalcetrapib分别增加血浆高密度脂蛋白胆固醇水平27%和54%。雄性日本白兔口服剂量30mg/kg或100mg/kg每日3次可显著增加血清中高密度脂蛋白胆固醇。Dalcetrapib可显著增加HDL-C水平。Dalcetrapib处理兔5和7月后和对照组相比, HDL 2-C比HDL 3-C比例明显增加, 表明Dalcetrapib对胆固醇酯转运蛋白活性的抑制影响了高密度脂蛋白亚组分的变化并优先增加HDL 2C含量。Dalcetrapib治疗增加血清酯酶活性和高密度脂蛋白相关的小板活化因子乙酰水解酶活性, 但可降低血浆溶血磷脂酰胆碱浓度。				
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	Dalcetrapib的IC ₅₀ 可降低rhCETP和C13S CETP介导由HDL向LDL的CE转移。测量使用闪烁接近法试剂盒。简单地讲, ³ H CE包被的HDL供体粒子、纯化的胆固醇酯转运蛋白(终浓度0.5μg/ml)和生物素标记的低密度脂蛋白受体粒子于37°C共培养3小时。随后, 添加链霉亲和素偶联多聚甲苯乙炔珠在含液体闪

	烁溶液中，选择性结合生物素标记的低密度脂蛋白，用β计数测量 ³ H]CE分子到LDL的转移量。
--	--

细胞实验	
细胞系	HepG2细胞系
浓度	0μM–30mM
处理时间	24小时
方法	肝癌HepG2细胞铺板于6孔板培养至70-80%汇合。用PBS洗后，细胞用含不同浓度(0μM-30μM，溶解于2%二甲基亚砷)的化学抑制剂Dalcetrapib处理24小时。制备用于RT-PCR检测的总RNA。

动物实验	
动物模型	四周雄性仓鼠
配制	0.5%甲基纤维素
剂量	100mg/kg
给药方式	口服灌胃

➤ **参考文献:**

- 1.Niesor EJ, et al. J Lipid Res. 2010, 51(12), 3443-3454.
- 2.Shinkai H, et al. J Med Chem. 2000, 43(19), 3566-3572.
- 3.Huang Z, et al. Am J Physiol Endocrinol Metab. 2003, 284(6), E1210-E1219.
- 4.Zhang B, et al. Arterioscler Thromb Vasc Biol. 2004, 24(10), 1910-1915.
- 5.Derks M, et al. Br J Clin Pharmacol. 2010, 70(6), 825-833.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD7207-10mM	Dalcetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7207-5mg	Dalcetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7207-25mg	Dalcetrapib (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