

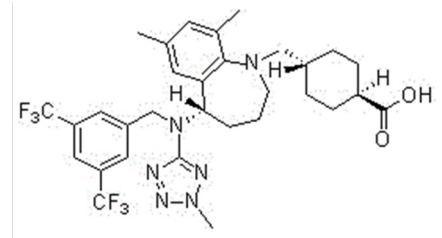
Evacetrapib (CETP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7234-10mM	Evacetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7234-5mg	Evacetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7234-25mg	Evacetrapib (CETP抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[[[(5S)-5-[[[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]methyl-(2-methyltetrazol-5-yl)amino]-7,9-dimethyl-2,3,4,5-tetrahydro-1-benzazepin-1-yl]methyl]cyclohexane-1-carboxylic acid
简称	Evacetrapib
别名	LY2484595, LY 2484595, LY-2484595
中文名	N/A
化学式	C ₃₁ H ₃₆ F ₆ N ₆ O ₂
分子量	638.65
CAS号	1186486-62-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 12.8mg/ml; Ethanol 12.8mg/ml
溶液配制	5mg加入0.78ml DMSO, 或每6.39mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7234-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Evacetrapib (LY2484595)是一种有效的, 选择性的CETP抑制剂, IC ₅₀ 为5.5nM, 增强高密度脂蛋白(HDL)胆固醇, 但没增强醛固酮或血压。Phase 3。				
信号通路	Metabolism				
靶点	CETP	—	—	—	—
IC ₅₀	5.5nM	—	—	—	—
体外研究	Evacetrapib (LY2484595)抑制人类血浆CETP蛋白, IC ₅₀ 为26nM。Evacetrapib (LY2484595)(<10μM)作用于H295R细胞, 不会诱导醛固酮或皮质醇合成。				
体内研究	Evacetrapib(LY2484595)按30mg/kg剂量口服给药处理人类ApoAI和CETP双转基因小鼠, 处理4小时、8小时、12小时后, 分别抑制98.4%、98.6%和18.4% CETP活性。Evacetrapib(LY2484595)(30mg/kg)口服处理8小时后, 导致HDL-C提高129.7%。剂量反应研究中, Evacetrapib(LY2484595)口服处理8小时后, 抑制CETP活性的ED ₅₀ 值分别为3.5mg/kg和4.1mg/kg。Evacetrapib(LY2484595)(<200mg/kg)处理Zucker糖尿病肥胖大鼠, 不增加血压。				
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	培养基含有分泌的重组CETP蛋白, 通过ELISA试剂盒进行定量分析(19ng/μl)。然后, 将培养基分装在0.2% BSA中, 并保存于-80°C下。储存的CETP蛋白在使用前在 CETP Buffer(10mM Tris, 150mM NaCl和2mM EDTA)中稀释150倍。实验在96孔板中进行。每孔含有97.5μl稀释的CETP蛋白(终浓度为7nM)和2.5μl化合物储存液。37°C下温育30分钟, 加入5μl底物储存液, 0.16μl VLDL储存液(2.5mg/ml)和145μl CETP Buffer, 再继续温育4小时。使用荧光酶标仪在544nm(激发)和595nm(发射)处测量荧光信号, 荧光胆固醇酯类似物转化为含apoB的脂蛋白。通过非线性回归测定IC ₅₀ 值。

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	人类ApoAI和CETP双转基因小鼠
配制	10% acacia
剂量	30mg/kg
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

1.Cao G, et al. J Lipid Res, 2011, 52(12), 2169-2176.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD7234-10mM	Evacetrapib (CETP抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7234-5mg	Evacetrapib (CETP抑制剂)	5mg
SD7234-25mg	Evacetrapib (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