

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	S11001
产品名称:	SB204990

产品简介:

一种 ATP 柠檬酸裂解酶 (ACLY) 的有效特异性抑制剂。

SB-204990 is the prodrug of the potent ATP citrate-lyase inhibitor SB-201076. SB-204990, when administered orally to rats, was absorbed into the systemic circulation; pharmacologically relevant concentrations of SB-201076 were recovered in the liver. SB-204990 (25 mg/kg per day) also decreased plasma cholesterol levels (by up to 23%) and triglyceride levels (by up to 38%) in the dog, preferentially decreasing low-density lipoprotein compared with high-density lipoprotein cholesterol levels. SB-204990 is an important enzyme in controlling substrate supply for lipid synthesis de novo and a potential enzyme target for hypolipidaemic intervention.

靶点: ACLY

体外研究:

SB204990 (SB) 是 ACLY 酶的特异性抑制剂。SB204990 治疗会导致细胞浆 Ac-CoA 水平降低, 因此预计会降低乙酰化和活性 β -catenin 水平。

体内研究:

SB 204990 在大鼠口服给药后, 会被吸收进入体循环。在饮食中 (0.05-0.25%, 重量百分比) 服用 1 周后, SB 204990 会导致大鼠血浆胆固醇 (最高 46%) 和甘油三酯水平 (最高 80%) 出现剂量相关性下降。SB 204990 (25 mg/kg/天) 还会降低狗的血浆胆固醇水平 (最高 23%) 和甘油三酯水平 (最高 38%), 与高密度脂蛋白胆固醇水平相比, 低密度脂蛋白胆固醇水平优先降低。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (≥ 100 mg/ml)

浓度	质量			
	溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM		2.5689 mL	12.8446 mL	25.6891 mL
5 mM		0.5138 mL	2.5689 mL	5.1378 mL
10 mM		0.2569 mL	1.2845 mL	2.5689 mL

储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year.

二: 体内实验

1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO \rightarrow 40% PEG300 \rightarrow 5% Tween-80 \rightarrow 45% Saline

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.34 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.34 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中, 混合均匀。2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.34 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： PBS

Solubility: 2.56 mg/mL (6.58 mM); 澄清溶液; 超声助溶

注：工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20°C

