

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	A10046
产品名称:	Atglistatin

产品简介:

一种高选择性脂肪甘油三酯脂酶(ATGL)抑制剂, IC ₅₀ : 0.7 μM。Atglistatin 通过靶向 ATGL 抑制细胞和器官培养中脂类分解。	
靶点:	IC ₅₀ : 0.7 μM (ATGL)
体外研究:	
Atglistatin 以剂量依赖性方式抑制野生型白色脂肪组织 (WAT) 的三酰甘油 (TG) 水解酶活性, 在最高浓度下抑制高达 78%。与野生型制剂相比, 来自 ATGL-ko 动物的 WAT 裂解物中的 TG 水解酶活性降低了大约 70%, 而 Atglistatin 对残留活性只有中等影响。Atglistatin 和激素敏感性脂肪酶(HSL) 抑制剂 Hi 76-0079 的联合使用导致 WAT 的 TG 水解酶活性几乎完全抑制 (-95%), 这表明大部分非 ATGL 活性可归因于 HSL。	
体内研究:	
动物通过口服饲法接受溶解在橄榄油中的阿格司他汀。应用后, 收集血液和组织用于测定血浆参数、组织三酰甘油 (TG) 水平和抑制剂浓度。时程实验表明脂肪分解参数脂肪酸 (FA) 和甘油在使用后 4 小时和 8 小时减少, 12 小时后恢复正常。处理后 8 小时, 观察到 FA 和甘油水平呈剂量依赖性降低, 分别高达 50% 和 62%。Atglistatin 还导致血浆 TG 水平显著降低 (-43%), 而血糖、总胆固醇、酮体和胰岛素水平没有显著变化。腹膜内注射 Atglistatin 也观察到脂肪分解的剂量和时间依赖性抑制。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
溶于 DMSO(56 mg/mL)和乙醇(4 mg/mL)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	3.5290 mL	17.6448 mL	35.2896 mL
5 mM	0.7058 mL	3.5290 mL	7.0579 mL
10 mM	0.3529 mL	1.7645 mL	3.5290 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→40% PEG300→5% Tween-80→ 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。			



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.82 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

3、请依序添加每种溶剂： Corn Oil

Solubility: 6.25 mg/mL (22.06 mM); 悬浊液; 超声助溶

4、请依序添加每种溶剂： 50% PEG300→50% Saline

Solubility: 20 mg/mL (70.58 mM); 悬浊液; 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。

三、激酶实验

脂肪酶活性测定:

对于脂肪酶活性的测定, 裂解物在包含放射性标记的[9, 10-³H(N)]三油精基质中培养。随后, FA 被提取出来, 并通过液体闪烁计数定量。数据由三次测定的平均 $\pm$ S.D. 得出, 并且代表至少三个独立试验。

四、细胞实验

细胞系: AML-12 老鼠肝细胞

浓度: ~ 50 μ M

处理时间: 2 小时

方法: 对基于 MTT 的体外存活测定试验, 细胞被接种于 96 孔板并在标准条件下培养 24 小时。第二天, 细胞用不同浓度的 Atglistatin 的 DMSO 溶液预处理 2 小时, 用 DMF 溶液预处理作为阳性对照。用同样的新鲜培养基替换之前的培养基, 在指定的时间点再次培养。此后, 细胞在 100 μ L 噻唑蓝四氮唑溴化物 (MTT) 存在下培养 3 小时。通过加入 100 μ L 的 MTT 增溶溶液 (0.1% NP-40, 4 mM HCl 和无水异丙醇) 使得到的紫色甲臞晶体溶解。甲臞产物完全溶解后, 吸光度在 595 nm 下以 690 nm 为参考波长进行测量。

五、动物实验

动物模型: 小鼠 (C57B1/6J)

剂量: 1.4 毫克/每只老鼠 (口服强喂法); ~ 400 μ mol/kg (腹腔注射)

给药处理: 口服强喂法或者腹腔注射

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

