

酮舍林酒石酸盐 ; Ketanserin Tartrate

产品编号 : MB1131

质量标准 : >98.5%,BR

包装规格 : 200MG;1G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C26H28FN3O9	结构式	
分子量	545.51		
CAS No.	83846-83-7		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 中溶解 51mg/ml ; H2O: 30 mg/mL (超声&加热辅助) ; 0.1M HCl 中溶解 6mg/ml; 乙醇 3.3mg/ml		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

熔点 :183-186°C

溶解性 :DMSO 中溶解 51mg/ml ;H2O: 30 mg/mL (超声&加热辅助) ;0.1M HCl 中溶解 6mg/ml;
乙醇 3.3mg/ml

含量 :≥99%

IC50 :半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - 129 mg/kga

生物活性

Description	Ketanserin tartrate is a selective 5-HT receptor antagonist. Ketanserin tartrate also blocks hERG current (I_{hERG}) in a concentration-dependent manner ($IC_{50}=0.11 \mu M$).
IC₅₀ & Target	IC ₅₀ : 0.11 μM (hERG current) IC ₅₀ : 152±23 μM (5-HT receptor)
In Vitro	Ketanserin at 0.3 μM inhibits the voltage-dependent step current ($I_{hERG.step}$) and tail current ($I_{hERG.tail}$) of hERG channels with a 5-min exposure. The synergistic effect observed for AA with 5-HT is, also, blocked by the 5-HT receptor blockers cyproheptadine ($IC_{50}=22.0\pm7 \mu M$), Ketanserin ($IC_{50}=152\pm23 \mu M$). Ketanserin (50-350 μM) inhibits the synergism by blocking the receptor in a dose-dependent manner. The IC_{50} value of Cyproheptadine is $22\pm7 \mu M$ and Ketanserin is $152\pm23 \mu M$. Ketanserin inhibits platelet aggregation with an IC_{50} of 240 (169-339) nM.
In Vivo	Ketanserin is a 5-HT _{2A} receptor antagonist. Ketanserin significantly reduces BDNF protein levels in numerous brain regions (CA1 and CA3 of the hippocampus, prefrontal cortex, central amygdaloid nucleus, dorsomedial hypothalamic nucleus, dentate gyrus, shell of the nucleus accumbens and

	midbrain periaqueductal gray). 5-HT _{2A} antagonist Ketanserin can significantly reduce BDNF mRNA levels in various brain regions
--	--

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面。本品具有阻断 5-HT₂ 受体作用和对 α 1 受体的微弱阻断作用，从而抑制 5-HT 诱发的血管收缩，降低外周血管阻力产生降压作用。此外本品还能抑制 5-HT 的促血小板聚集作用，抑制儿茶酚胺类物质的血管收缩效应。对 H1 受体也有一定抑制作用。对正常人血压和心率影响较小。

使用方法推荐：

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8331 mL	9.1657 mL	18.3315 mL
5 mM	0.3666 mL	1.8331 mL	3.6663 mL
10 mM	0.1833 mL	0.9166 mL	1.8331 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（仅供参考）

Cell Assay	<p>Ketanserin is dissolved in DMSO to produce a stock solution of 100 mM. Ketanserin stock is diluted in experimental solutions to achieve the final concentrations^[1].</p> <p>The established HEK 293 cell line stably expressing hERG channels is cultured in Dulbecco's modified Eagle's medium (DMEM) supplemented with 10% foetal bovine serum, 400 μg/mL G418. The HEK 293 cell line stably expressing recombinant human cardiac KCNQ1/KCNE1 channel current (I_{Ks}) is maintained in DMEM containing 10% foetal bovine serum and 100 μg/mL hygromycin. Cells used for electrophysiology are seeded on a glass coverslip. The mutant hERG channels are constructed, and are transiently expressed in HEK 293 cells using 10 μL of Lipofectamine 2000 with 4 μg of hERG mutant cDNA in pCDNA3 vector. MCE has not independently confirmed the accuracy of these methods. They are for reference only.</p>
Animal Administration	<p>Ketanserin is 0.9% physiological saline group (Rat).</p> <p>Rat</p> <p>A total of 155 specific-pathogen-free 2-month-old male Sprague-Dawley rats, weighing 180-220 g, are used. The rats are randomly divided into the following six groups: 5-HT_{1A} receptor agonist (8-OH-DPAT) PS group (DPAT-PS group, n=30); 5-HT_{1A} receptor antagonist (MDL73005) PS group (MDL-PS group, n=30); 5-HT_{2A} receptor agonist (DOI) PS group (DOI-PS group, n=30); 5-HT_{2A} receptor antagonist (Ketanserin) PS group (Ketan-PS group, n=30); the solvent control no-stress group (0.9% physiological saline group, CON group); and the PS only group (PS group, n=30). The DPAT-PS, MDL-PS, DOI-PS, Ketan-PS and PS groups are further divided into six subgroups (n=5 each)</p>

	according to the time between the stress and analysis; immediately after stress, and 0.5, 1, 2, 6 and 24 hours after stress. The CON group (n=5) receive normal feed. For the Ketan-PS group, Ketanserin, dissolved in 0.9% physiological saline, is injected intraperitoneally at 5 mg/kg at 1 hour before each stress exposure. MCE has not independently confirmed the accuracy of these methods. They are for reference only.
--	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。