

帕潘立酮 ; Paliperidone

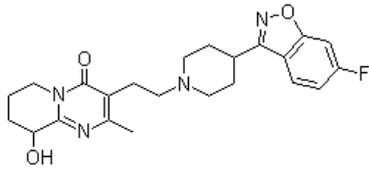
产品编号 : MB1280

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C23H27FN4O3	结 构 式	
分子量	426.48		
CAS No.	144598-75-4		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 4 mg/mL warmed (9.37 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
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

溶解性：.....DMSO 4 mg/mL warmed (9.37 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

 密度：.....1.45 g/cm³ (预测)

含量：.....98% to 102%

IC50 :HERG: IC50 = 1.29 nM (人)

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - 65 mg/kg

生物活性

产品描述	Paliperidone，作为 Risperidone 主要的活性代谢物，是一种高效的 serotonin-2A 和 dopamine-2 receptor 拮抗剂，用于治疗精神分裂症。
靶点	Dopamine receptor
体外研究	Paliperidone 浓度依赖性显著增加 Rh123 和 DOX 在细胞内的累积。Paliperidone 在低浓度(10 和 50 μM)下很好地作用于 Aβ(25-35) 和 MPP(+), 并且仅保护 SH-SY5Y 免受过氧化氢损害。Paliperidone (100 μM)完全减少不同压力诱导的细胞减少，而与其剂量无关。Paliperidone 在许多方面比其他 APDs 具有更高的氧化应激-清除作用，比如产生大量谷胱甘肽，低 HNE，和蛋白羰基产品。Paliperidone 在最高剂量下增强多巴胺毒性，并且是唯一的 AP，与多巴胺单独处理的细胞相比，显著增加细胞活性(8.1%)。
体内研究	Paliperidone 恢复大鼠前额叶皮质基底层细胞外的谷氨酸盐。在大鼠中，Paliperidone 也会防止急性 MK-801 诱导的细胞外谷氨酸盐增加。Paliperidone 与 Escitalopram 联合给药恢复 NE 神经元放电率的抑制和神经元突然放电的百分比。Paliperidone 在有效剂量下以剂量依赖的方式减少咬和攻击行为。Paliperidone 导致攻击行为极大减少。

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，严禁用于人体。本品为苯并异噻唑的衍生物，为利培酮的活性代谢产物 9-羟基利培酮，为一新型抗精神病药物，其作用机制仍未完全清楚，可能与多巴胺 D2 和 5-羟色胺 2A (5HT2A) 的阻滞作用有关，其对肾上腺素 α 1、 α 2 和组胺 H1 受体有阻滞作用，对胆碱和肾上腺素 β 1 及 β 2 受体无亲和力，其左旋和右旋体在体外药理作用相似。此外，还能升高催乳素水平。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.3448 mL	11.7239 mL	23.4478 mL
5 mM		0.4690 mL	2.3448 mL	4.6896 mL
10 mM		-	-	-
50 mM		-	-	-

【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。