

## Rizatriptan benzoate ; 苯甲酸利 ; 扎曲普坦 ; 利扎曲坦

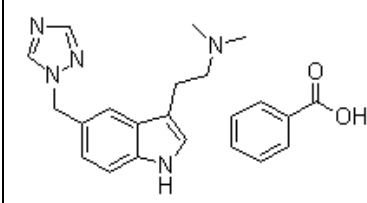
产品编号 : MB1619

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 200MG ; 1G

产品形式 : 白色或类白色粉末

### 基本信息

分子式	C15H19N5.C7H6O2	结构式	
分子量	391.47		
CAS No.	145202-66-0		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	H <sub>2</sub> O: ≥ 5 mg/mL DMSO 20 mg/mL (51.08 mM) 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。		

**简介 :** 利扎曲坦苯甲酸盐 Rizatriptan 苯甲酸盐(Maxalt)是 5-HT1 激动剂。

**别名 :** MK-462 Benzoate ; MK-462,

N,N-Dimethyl-2-[5-(1,2,4-triazol-1-ylmethyl)-1H-indol-3-yl]ethylamine benzoate salt

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或类白色粉末

熔点 : .....177°C~181°C

溶解性 : .....H<sub>2</sub>O: ≥ 5 mg/mL ; DMSO 20 mg/mL (51.08 mM) ; Ethanol Insoluble

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....≥99.0%

IC<sub>50</sub> : .....SR-1D: IC<sub>50</sub> = 11 nM (人); 血清素 1d (5-HT1d)受体 : IC<sub>50</sub> = 16 nM (野猪);

.....SR-1B: IC<sub>50</sub> = 41 nM (人); SR-1A: IC<sub>50</sub> = 316.23 nM (人);

.....血清素 3 (5-HT3)受体 : IC<sub>50</sub> = 3.98 μM (大鼠)

**储存条件 :** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Rizatriptan Benzoate 是 5-HT1 激动剂, 是一种曲坦类治疗偏头痛的药物。
<b>靶点</b>	5-HT1
<b>体内研究</b>	在麻醉豚鼠中, Rizatriptan 通过血管周围三叉神经的 5-HT(1D) 受体作用阻断神经性血管舒张, 抑制 CGRP 释放。在麻醉豚鼠中, Rizatriptan 唤起硬脑膜血管直径瞬时减少, 并在 10 分钟内恢复到基线值。Rizatriptan 显著抑制三叉神经节高强度的电刺激产生的硬脑膜血浆蛋白外渗。在麻醉大鼠中, Rizatriptan 显著降低电刺激的硬脑膜血管扩张。在正常和模型组大鼠的中脑中, Rizatriptan Benzoate 显著减少 SP mRNA 水平, 这说明 Rizatriptan Benzoate 能下调大鼠的中脑中 SP 基因的表达。在偏头痛大鼠模型中, Rizatriptan Benzoate 显著降低中脑中 PENK mRNA 水平, 降低中脑中脑啡肽和亮氨酸脑啡肽的含量, 从而削弱了内源性疼

	痛调节系统的镇痛作用。在清醒大鼠中，Rizatriptan Benzoate 导致 Fos 样阳性神经元数量在三叉神经脊束核尾 partand 缝大核下降，在 periaqueductal 灰质中增加和留在下丘脑腹内侧核和 mediodorsal 丘脑核中不变。在大鼠中，Rizatriptan Benzoate 显著减少 head-flicks 的数量。与未经治疗的对照组相比，Rizatriptan Benzoate 也显著减少梳理行为的持续时间近 2 倍。
--	---

**美仑相关产品推荐**

MB25299	N10-单一去甲基利扎曲坦-d3
MB1619-S	苯甲酸利扎曲普坦（标准品）
MB25298	苯甲酸利扎曲坦-d6
MB2081	利扎曲坦

**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。利扎曲普坦对克隆人 5-HT1B 和 5-HT1D 具有高度的亲和力，对其它 5-HT1 受体和 5-HT7 受体亲和力较低，对 5-HT2、5-HT3、肾上腺素、DA、组胺、胆碱或 BZ 受体无明显活性。利扎曲普坦激动偏头痛发作时扩张的脑外、颅内血管以及三叉神经末梢上的 5-HT1B/1D，导致颅内血管收缩，抑制三叉神经疼痛通路中神经肽的释放和传递，而发挥其治疗偏头痛作用。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5545 mL	12.7724 mL	25.5447 mL
5 mM	0.5109 mL	2.5545 mL	5.1089 mL
10 mM	0.2554 mL	1.2772 mL	2.5545 mL
50 mM	0.0511 mL	0.2554 mL	0.5109 mL

**【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。