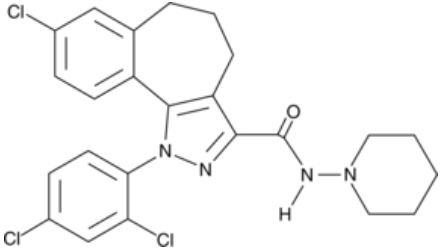


**NESS0327 ; NESS-0327**

产品编号：MB2606  
 质量标准：>98%,BR  
 包装规格：1MG  
 产品形式：结晶固体

**基本信息**

分子式	C24H23Cl3N4O	结 构 式	
分子量	489.8		
CAS No.	494844-07-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	Soluble in DMSO		
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：.....结晶固体  
 溶解性：.....Soluble in DMSO  
 纯度：.....>98%,BR

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

**生物活性及研究进展：**

<b>产品描述</b>	Ki：CB1 和 CB2 受体分别为 0.35pM 和 21nM。 NESS 0327 是一种非常有效的大麻素 (CB) 受体拮抗剂。大麻素 CB1 受体存在于中枢神经系统中，海马密度最高，在一些外周组织中程度较低。大麻素 CB2 受体主要位于外周组织中。两种受体都能负调节腺苷酸环化酶并控制花生四烯酸的释放。
<b>靶点</b>	GPCR/G protein
<b>信号通路</b>	Cannabinoid Receptor
<b>体外研究</b>	以前的研究发现 NESS 0327 与 SR 141716A 相比，对 CB1 受体 GPCR / G 蛋白大麻素受体表现出更强的选择性，显示对 CB1 受体的亲和力更高且对 CB2 受体具有更高的亲和力。亲和力比值表明 NESS 0327 对 CB1 受体的选择性超过 60,000 倍。单独的 NESS 0327 在大鼠小脑膜中不产生浓度依赖性刺激鸟苷 5'-O-(3-[35S]硫代)-三磷酸结合。相反，NESS 0327 拮抗 WIN 55,212-2-刺激的鸟苷 5'-O-(3-[35 S]硫)-三磷酸结合。在功能测定中,NESS 0327 可以拮抗 WIN 55,212-2

	对小鼠分离输精管制剂电诱发收缩的抑制作用。
<b>体内研究</b>	体内研究表明, NESS 0327 可以拮抗 WIN 55,212-2 在尾甩和热板试验中产生的抗感伤害作用, 表明 NESS 0327 是一种新型大麻素拮抗剂, 对大麻素 CB1 受体具有高选择性。

**美仑相关产品推荐**

CL-10902	Rimonabant	利莫那班
MB2165	利莫那班羧酸	Rimonabant carboxylic acid

**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。NESS-0327 是一种用于科学研究的药物, 它作为大麻素受体 CB1 的一种极有效的选择性拮抗剂。它是一种更有效的拮抗剂, 对 CB1 受体比 CB2 更有选择性, 比常用的配体 rimonabant 更强, 在 CB1(即 0.00035nM)的 CB1 上有  $K_i$ , 在 CB1 的 CB1 上有超过 60000 x 的选择性。另外两组只描述了这种化合物(125nM 和 18.4nM)的纳米分子 CB1 亲和力。与利莫那班(rimonabant)不同的是, NESS-0327 在高剂量时似乎并不是一个反向激动剂, 相反, 它是一个纯中性的拮抗剂, 阻断了 CB1 受体, 但不会产生任何生理效应。

**【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。