

S1RA ; S1RA HCl

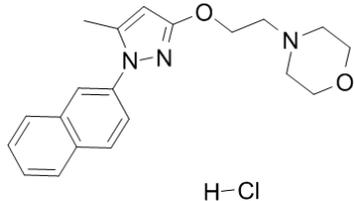
产品编号：MB2639

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG; 25MG

产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₂₄ ClN ₃ O ₂	结构式	
分子量	373.88		
CAS No.	878141-96-9 (base) 1265917-14-3(HCl)		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : ≥ 57 mg/mL (152.46 mM) Water : 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：S1RA(E-52862)盐酸盐是高活性和选择性的 sigma-1 受体 (σ₁R) 拮抗剂，K_i 为 17nM，而对 σ₂R 的 K_i 则高于 1000nM。

别名：E-52862 hydrochloride; S1RA HCl ; Morpholine,

4-[2-[[5-methyl-1-(2-naphthalenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxy]ethyl]-, hydrochloride (1:1)

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : ≥ 57 mg/mL (152.46 mM) ; Water : insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

S1RA Hcl(E-52862 Hcl)是一种有效的选择性 1 受体(1R,K_i=17nM)拮抗剂,对 2R(K_i>1000nM)具有较好的选择性。IC₅₀ 值：17 nm (K_i) 靶点：体外 SGR 1R 拮抗剂：S1RA 表现为高度选择性的 1 型受体拮抗剂。2 受体与人(K_i=17nM)和豚鼠(K_i=23.5nM)1 受体的亲和力较高,而对豚鼠和大鼠 2 受体的亲和力不显著(K_i>1000nM)。5-HT_{2B} 受体具有中等亲和力(K_i=328nM)和极低效价(IC₅₀=4700nM)的拮抗活性。S1RA 对其它 170 个靶点(受体、转运体、离子通道和酶)没有明显的亲和力(K_i>1μM 或 1μM<50%)。体内：对照组(非手术)和神经损伤小鼠接受单一或重复(每天两次,持续 12 天)即给予 S1RA 25 mg·kg。同样的剂量用于评估慢性变态反应研究中的行为超敏反应。术后第 12 天进行急性治疗,并在手术当天开始反复进行 S1RA 治疗,如行为研究。唑啉沙星鞘内预处理阻止了 S1RA 的全身抗伤害作用,表明 S1RA 的抗伤害作用依赖于脊髓α₂-肾上腺素受体的激活,而脊髓α₂-肾上腺素受体又可以诱导福尔马林诱导的谷氨酸释放的抑制。当局部给药时,鞘内注射 S1RA 仅抑制退缩行为,而侧脑室注射或植物内注射也减弱了抬起/舔舐行为。

美仑相关产品推荐

MB2636	AVex-73 hydrochloride
--------	-----------------------

MB2637

Siramesine

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。本品是高活性和选择性的 sigma-1 受体 ($\sigma 1R$) 拮抗剂。可用于相关领域科研实验。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6747 mL	13.3733 mL	26.7465 mL
5 mM	0.5349 mL	2.6747 mL	5.3493 mL
10 mM	0.2675 mL	1.3373 mL	2.6747 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。