

## PRX-08066 Maleic acid ; PRX-08066

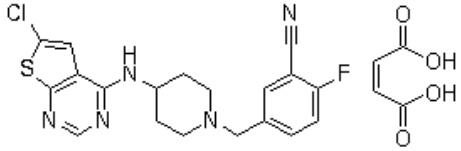
产品编号 : MB3806

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C19H17ClFN5S.C4H4O4	结 构 式	
分子量	517.96		
CAS No.	866206-55-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 104 mg/mL (200.78 mM) Water : 104 mg/mL (200.78 mM) Ethanol : 98 mg/mL (189.2 mM)		
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 :** PRX-08066 是一种选择性 5-HT<sub>2B</sub> 受体拮抗剂, IC<sub>50</sub> 为 3.4 nM, 可预防 MCT 大鼠肺动脉高压的严重程度。

**别名 :** Benzonitrile, 5-[4-[(6-chlorothieno[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino]-1-piperidinyl]methyl]-2-fluoro-, (2Z)-2-butenedioate (1:1)

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 104 mg/mL (200.78 mM);Water : 104 mg/mL (200.78 mM);Ethanol : 98 mg/mL (189.2 mM)

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	PRX-08066 Maleic acid 是一种选择性的 5-HT <sub>2B</sub> 受体拮抗剂, IC <sub>50</sub> 为 3.4 nM, 作用于 MCT 大鼠模型, 防止肺动脉高压的严重性。Phase 2。
<b>特性</b>	RX-08066 是选择性 5-HT <sub>2BR</sub> 拮抗剂, 比作用于紧密相关的 5-HT <sub>2A</sub> 和 5-HT <sub>2C</sub> 受体和其他受体靶点选择性高很多。

<b>靶点</b>	5-HT2B 3.4 nM
<b>体外研究</b>	<p>PRX-08066 抑制 5-HT 诱导的有丝分裂原活化蛋白激酶激活, IC50 为 12 nM, 作用于表达人类 5-HT2BR 的中国仓鼠卵巢细胞, 显著降低胸苷掺入, IC50 为 3 nM, 说明 PRX-08066 可抑制病理 5-HT 诱导的肺动脉高压相关的血管肌型化。PRX-08066 作用于表达 5-HT(2B)的 SI-NET 细胞系, KRJ-I, 抑制细胞增殖, IC50 为 0.46 nM, 最大抑制达 20%, 抑制 5-HT 分泌, IC50 为 6.9 nM, 最大抑制达 30%。PRX-08066 作用于 NCI-H720 细胞, 抑制异丙基肾上腺素刺激的 5-HT 释放, IC50 为 1.25 nM, 最大抑制达 60%。PRX-08066(0.5 nM)作用于 KRJ-I 细胞, 显著抑制 ERK 磷酸化。PRX-08066 作用于 KRJ-I 细胞, 抑制 TGFβ1, CTGF 和 FGF2 转录和分泌。PRX-08066 作用于 KRJ-I 细胞, 降低 Ki67(84%) 转录和 Ki67 蛋白(36.8%)水平。提高 caspase 3 转录水平。PRX-08066 作用于 KRJ-I 细胞, 降低 TGFβ1, FGF2 和 TPH1 转录水平。PRX-08066 作用于 KRJ-I 细胞, 与未处理的对照组相比, 显著增加死亡细胞数(34%)。PRX-08066 作用于 HEK293 细胞, 显著提高 dead/caspase 3 阳性细胞 (76%) 和 caspase 3 活性(52%)。</p>
<b>体内研究</b>	<p>PRX-08066 (100 mg/kg)处理大鼠, 与 Monocrotaline 处理的对照组相比, 右心室肥大和室间隔展平降低。PRX-08066 按 50 mg/kg 和 100 mg/kg 剂量处理大鼠, 与 Monocrotaline 处理的对照组相比, 显著降低肺动脉压峰值。PRX-08066 处理大鼠, 与 MCT 处理的对照组相比, 也显著降低右心室 (RV) /体重和 RV/左心室+室间隔。PRX-08066 显著降低肺动脉压力升高和 RV 肥大, 并维持心脏功能。PRX-08066 处理大鼠和小鼠, 显著降低缺氧依赖性的右心室收缩压升高, 不影响动物的全身平均动脉压。PRX-08066 (100 mg/kg) 处理大鼠, 显著抑制右心室收缩压和右心室/左心室+室间隔升高。PRX-08066 (30 mg/kg)作用于整个大鼠肺组织匀浆, 抑制右心室收缩压, 和 Monocrotaline 诱导的 ERK 磷酸化。</p>

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB3676	BRL-54443
MB3673	LY310762
MB3737	WAY-100635 Maleate

**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 PRX-08066 是一种选择性 5-HT2B 受体拮抗剂, 可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9307 mL	9.6533 mL	19.3065 mL
5 mM	0.3861 mL	1.9307 mL	3.8613 mL
10 mM	0.1931 mL	0.9653 mL	1.9307 mL

50 mM	0.0386 mL	0.1931 mL	0.3861 mL
-------	-----------	-----------	-----------

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验 :</b>	<p><b>Cell lines:</b> KRJ-I 细胞系</p> <p><b>Concentrations:</b> ~1 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 24 小时</p> <p><b>Method:</b> 细胞按 <math>5 \times 10^3</math> 个/mL 接种在 96 孔板中, 使用 PRX-08066 (0.1 <math>\mu</math>M 到 100 nM) 刺激。24 小时后, 加入 MTT 3 小时, 测定线粒体活性。使用酶标仪在 595 nm 处光谱测定读取光密度。结果归一化为对照组 (未刺激的细胞), 计算半最大有效浓度。</p>
<b>动物实验 :</b>	<p><b>Animal Models:</b> 雄性 Sprague-Dawley 大鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 0.5% 甲基纤维素(w/v)</p> <p><b>Dosages:</b> 100 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理</p>

**【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, 否则会严重影响化合物活性, 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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差, 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。