

## ADL5859 HCl

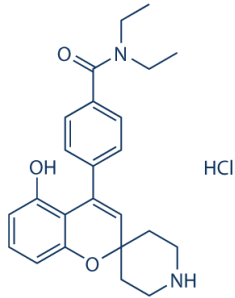
产品编号：MB3830

质量标准：>98%， $\delta$ -opioid receptor 激动剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

## 基本信息

|          |                                                                                          |             |                                                                                     |
|----------|------------------------------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 分子式      | C24H28N2O3.HCl                                                                           | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量      | 428.95                                                                                   |             |                                                                                     |
| CAS No.  | 850173-95-4                                                                              |             |                                                                                     |
| 储存条件     | -20℃，避光防潮密闭干燥                                                                            |             |                                                                                     |
| 溶解性(25℃) | DMSO : 86 mg/mL (200.48 mM)<br>Water : 5 mg/mL (11.65 mM)<br>Ethanol : 1 mg/mL (2.33 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：**ADL5859 是 $\delta$ -阿片受体选择性激动剂，对 hERG 有弱抑制性。**别名：**Benzamide, N,N-diethyl-4-(5-hydroxyspiro[2H-1-benzopyran-2,4'-piperidin]-4-yl)-, hydrochloride (1:1)**物理性状及指标：**

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 86 mg/mL (200.48 mM) ; Water : 5 mg/mL (11.65 mM) ; Ethanol : 1 mg/mL (2.33 mM)

含量：.....&gt;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>            | ADL5859 HCl 是 $\delta$ -opioid receptor 激动剂，K <sub>i</sub> 为 0.8 nM,选择性作用于 opioid receptor $\kappa$ , $\mu$ ,对 hERG 通道具有微弱的抑制活性。 |                         |                         |
| <b>靶点</b>              | $\delta$ -阿片类受体                                                                                                                  | $\mu$ -阿片类受体            | $\kappa$ -阿片类受体         |
| <b>IC<sub>50</sub></b> | 0.8 nM (K <sub>i</sub> )                                                                                                         | 32 nM (K <sub>i</sub> ) | 37 nM (K <sub>i</sub> ) |

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
|------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 体外研究 | 在 32nM 和 37nM Ki 条件下 ADL5859 独立刺激 $\delta$ -阿片类受体的特异选择性比 $\mu$ -或者 $\kappa$ -阿片类受体高 1000 倍。在 78uM IC50 条件下，ADL5859 表现出对 hERG 通道的弱的抑制效应。ADL5859 对 $\delta$ -阿片类受体的 EC50 值是 20nM                                                                                                                                                                                                                          |
| 体内研究 | 在 3 mg/kg 口服的筛选条件下, ADL5859 在发炎爪子实验中可以造成 100%的痛觉过敏逆转现象。ADL5859 在 FCA 痛觉过敏机制实验中的口试 ED50 值是 1.4 mg/kg.由 ADL5859 造成的抗痛觉过敏现象可以被 $\delta$ -阿片类受体拮抗剂 ( 0.3 mg/kg 皮下注射纳曲酮 ) 的预处理所逆转，因此证明了 $\delta$ -阿片类受体参与介导反应。在大鼠强迫性游泳试验中，ADL5859(3 mg/kg 口服)可以产生很强的与抗抑郁类似的作用, 可以看到大鼠停顿时间的显著下降和游泳时间的显著上升。ADL5859(3 mg/kg 口服)在大鼠和狗身上的生物利用度分别是 33%和 66%。ADL5859 可以高效的减轻炎症反应和神经疼痛，它主要通过募集由外周 Nav1.8 表达神经元表达的 $\delta$ -阿片类受体起作用 |
| 特征   | ADL5859 是一个潜在的、选择性的、口服的有生物活性的阿片类兴奋剂。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |

### 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)

|         |                |
|---------|----------------|
| MB11651 | 阿片受体拮抗剂        |
| MB4790  | Naltrexone HCL |
| MB5693  | 盐酸纳洛酮          |

**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 ADL5859 是 $\delta$ -阿片受体选择性激动剂，对 hERG 有弱抑制性。可用于相关领域的科研实验。

### 储液配置

| 体 质 量<br>浓度 积 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|---------------|-----------|------------|------------|
| 1 mM          | 2.3313 mL | 11.6564 mL | 23.3127 mL |
| 5 mM          | 0.4663 mL | 2.3313 mL  | 4.6625 mL  |
| 10 mM         | 0.2331 mL | 1.1656 mL  | 2.3313 mL  |
| 50 mM         | 0.0466 mL | 0.2331 mL  | 0.4663 mL  |

### 经典实验操作 ( 仅供参考 )

|       |                                                                                                                                                  |
|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 细胞实验： | <b>Cell lines:</b> 稳定表达 $\kappa$ 、 $\mu$ 、和 $\delta$ 阿片类受体的中华仓鼠卵巢细胞系 (CHO)<br><b>Concentrations:</b> 0 nM-10 nM<br><b>Incubation Time:</b> 60 分钟 |
|-------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

|       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|-------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|       | <p><b>Method:</b> 从稳定表达人<math>\kappa</math>、<math>\mu</math>、和<math>\delta</math>阿片类受体的中华仓鼠卵巢细胞中制备细胞膜。实验缓冲液中含有, 50mM Tris(羟甲基)盐酸甲胺, PH 7.8 ; 1.0 mM 乙二醇双(<math>\beta</math>-氨基乙基醚)-N,N,N',N'-四乙酸 (无 EGTA 酸) ; 5.0 mM <math>MgCl_2</math> ; 10 mg/L 亮肽素 ; 10 mg/L 胃酶抑素 A ; 200 mg/L 杆菌肽和 0.5 mg/L 抑肽酶。用缓冲液稀释膜蛋白, 用 Polytron 匀质化 30 秒后, 将 250<math>\mu</math>L 含膜蛋白(10-80<math>\mu</math>g)的缓冲液加入到含有 ADL5859 和 [<math>^3H</math>]diprenorphine (0.5-1.0 nM, 25000-50000 dpm)的 250<math>\mu</math>L 缓冲液中。放置于 96 孔聚苯乙烯深孔检测板中, 在室温孵育 60 分钟。反应通过真空过滤来终止, 使用 Brandel MPXR-96T 收集器让液体通过由 0.5%聚乙烯亚胺和 0.1%牛血清白蛋白预处理至少一个小时的 GF/B 滤膜。滤膜用 1mL 冰上预冷的 50mM Tris-HCL, PH7.8 溶液洗四次, 然后将 30<math>\mu</math>L 的 Microscint-20 加入到每张滤纸上。每张滤纸的放射性用闪烁光谱法通过 Packard TopCount 检测。 [<math>^3H</math>]Diprenorphine 带有一个特定的 50 Ci/mmol活性。 [<math>^3H</math>]Diprenorphine 结合的检测值 <math>K_d</math> 对<math>\kappa</math>和<math>\mu</math>受体是 0.33nM, 对<math>\delta</math>受体是 0.26nM。受体蛋白表达水平通过 <math>B_{max}</math> 值进行检测, 用 Scatchard 法分析, <math>\kappa</math>、<math>\mu</math>、和 受体分别是 4400、4700 和 2100 fmol/mg 蛋白。初步实验结果表明, 在洗膜过程中并没有特异性结合的损失, 结合能力会在孵育过程中会达到一个平衡并能够在平衡点至少保持 60 分钟, 并且结合能力相对于蛋白浓度呈现出一个线性规律。非特异性结合方面, 检测 10<math>\mu</math>M 未标记的 naloxone, 产生的背景低于总结合数值的 10%。蛋白浓度通过 Bradford 法进行定量。竞争性实验的数据通过非线性回归法进行处理, 使用 Prism 软件的 four-parameter equation 法计算每一个竞争点, 随后 <math>K_i</math> 值也通过 Cheng-Prusoff equation 用 <math>EC_{50}</math> 值计算出来。</p> |
| 动物实验: | <p><b>Animal Models:</b> Nav1.8-cKO 小鼠, CMV-KO 小鼠, C57BL6/J <math>\times</math>; SV129Pas 小鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 配制在 0.5% 羟丙基甲基纤维素, 含有 0.1% Tween-80</p> <p><b>Dosages:</b> 10 mg/kg - 300 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 口服</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。