

(-)-MK-801 Maleate ; (-)-MK 801 Maleate

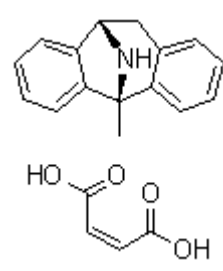
产品编号 : MB4085

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C16H15N.C4H4O4	结 构 式	
分子量	337.37		
CAS No.	121917-57-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 67 mg/mL (198.59 mM) Water Insoluble Ethanol 7 mg/mL (20.74 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 : (-)-MK 801 Maleate 是 (+)-MK-801 的对映体, (+)-MK-801 是高效选择性, 选择性的, 非竞争性的 NMDA 受体拮抗剂。

别名 : 5H-Dibenzo[a,d]cyclohepten-5,10-imine, 10,11-dihydro-5-methyl-, (5R,10S)-, (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 : 67 mg/mL (198.59 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 7 mg/mL (20.74 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	MK-801 (Dizocilpine)是一种有效的 N-methyl-D-aspartate(NMDA)受体拮抗剂, K_i 为 30.5 nM。
靶点	NMDA receptor

	30.5 nM(Ki)
体外研究	体外神经生理学研究使用大鼠皮质切片制剂，证明了 dizocilpine 对 N-Me-D-Asp 去极化响应具有有效的，选择性的，非竞争性的拮抗作用，但是对红藻氨酸或使君子氨酸无此作用。Phencyclidine, ketamine, SKF 10047, 和 dizocilpine 的对映异构体，作为 N-Me-D-Asp 拮抗剂的效能与它们作为[3H] dizocilpine 结合抑制剂的效能密切相关。这表明，dizocilpine 结合位点与 N-Me-D-Asp 受体相关，并解释了 dizocilpine 作为抗痉挛剂的作用机制。
体内研究	在脊髓缺血性损伤(ISCI)后，所有对照组大鼠患有严重的永久性神经功能缺损，而 dizocilpine 治疗的大鼠具有统计学上(P < .05)更好的神经功能，并且恢复良好。组织病理学表明对照组大鼠的腰灰质出现严重的神经元坏死，而 dizocilpine 处理的大鼠仅表现出轻度损伤。这些结果表明，ISCI 之前，dizocilpine 单剂量给药提供显著的神经保护作用。

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)

MB3539	ACPC;1-氨基环丙烷羧酸
MB4244	GLYX-13
MB3798	NMDA (N-甲基-D-天门冬氨酸)

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 (+)-MK-801 的对映体，(+)-MK-801 是高效选择性，选择性的，非竞争性的 NMDA 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	2.9641 mL	14.8205 mL	29.6410 mL
5 mM	0.5928 mL	2.9641 mL	5.9282 mL
10 mM	0.2964 mL	1.4821 mL	2.9641 mL
50 mM	0.0593 mL	0.2964 mL	0.5928 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>体外结合试验:</p> <p>对于体外结合试验，来自雄性 Sprague-Dawley 大鼠(200-300 g)的脑皮层在 9 体积冰预冷的蔗糖中通过 9 个冲程聚四氟乙烯/玻璃均质器以 500 rpm 均质化。匀浆以 1000 x g 离心 10 分钟，上层清液以 10,000 x g 在 4 °C 下再离心 20 分钟。将沉淀重悬浮在试验缓冲液中，培育 20 分钟，最后以 10,000 x g 在 4 °C 下离心 20 分钟。将沉淀重悬浮在试验缓冲液中(70 ml 每克原组</p>
-------------	---

	<p>织)。[3H] dizocilpine 的结合通过将 750 ul 重复两等分的粗品细胞膜悬浮液(=0.75 mg 蛋白质), 与 100 ul 包含置换剂的缓冲液或单独的缓冲液(总结和), 100 ul 50 nM [3H] dizocilpine , 和 50 ul 缓冲液在 23 °C下培育 60 分钟测量。非结合测定通过未标记的 dizocilpine 定义。培育通过 Whatman GF/B 过滤器快速过滤终止, 其立即用两个 5-ml 冰预冷的试验缓冲液在 Brandel M 24-R 细胞采集器中洗涤。需要完成过滤和洗涤过程的时间少于 10 秒。过滤器上的放射性通过液体闪烁计数, 在标准药瓶中用 10 ml Hydrofluor 以 41% 计数效率测定。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 混合神经元/胶质细胞培养物 Concentrations: 10 μM Incubation Time: 30 分钟 Method: 原代混合的神经元/神经胶质培养基从胎鼠大脑制备。将成熟的培养基暴露在溶解的 isoflurane [0.4 mM (1.8 最小肺泡浓度) 或 1.6 mM (7 最小肺泡浓度)] 或 dizocilpine (10 μM), 和 NMDA (0 或 3 μM)下, 在 37 °C下进行 30 分钟。细胞凋亡使用末端-脱氧-核苷酸缺口末端标记的寡聚核小体 DNA 片段酶联免疫吸附法, 和 caspases-3 和-9 活化法评估。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 缺血性脊髓损伤模型 Formulation: N/A Dosages: 1 mg/kg Administration: IV</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, 否则会影影响化合物活性, 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。