

Nepicastat (SYN-117) HCl ; 盐酸内匹司他

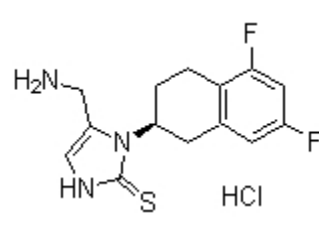
产品编号 : MB4349

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₁₄ H ₁₅ F ₂ N ₃ S.HCl	结 构 式	
分子量	331.81		
CAS No.	170151-24-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 66 mg/mL (198.9 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 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 : Nepicastat(SYN117; RS-25560-197)盐酸盐是多巴胺_beta_羟化酶高效抑制剂。

别名 : 内匹司他盐酸盐 ; SYN-117 hydrochloride; RS-25560-197 hydrochloride ;

2H-Imidazole-2-thione,

5-(aminomethyl)-1-[(2S)-5,7-difluoro-1,2,3,4-tetrahydro-2-naphthalenyl]-1,3- dihydro-,

hydrochloride (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :白色至淡黄色固体

溶解性 :DMSO : 66 mg/mL (198.9 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

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	Nepicastat (SYN-117) HCl 是一种有效的, 选择性的牛和人类 dopamine-β-hydroxylase (多巴胺-β-羟氨) 抑制剂, IC ₅₀ 分别为 8.5 nM 和 9 nM, 对 12 种其他酶 13 种神经递质受体几乎没有亲和力。	
靶点	Bovine dopamine-beta-hydroxylase 8.5 nM	Human dopamine-beta-hydroxylase 9 nM
体外研究	在体外, Nepicastat hydrochloride 对牛和人多巴胺-β-羟化酶表现出选择性和浓度依赖性抑制作用, IC ₅₀ 分别为 8.5 nM 和 9.0 nM。Nepicastat hydrochloride 对 12 种其他酶和 13 种神经递质受体具有很低的亲和力。	
体内研究	在自发性高血压大鼠(SHRs)的动脉, 左心室和大脑皮层中, Nepicastat hydrochloride 剂量依赖性降低去甲肾上腺素含量, 增加多巴胺含量和多巴胺/去甲肾上腺素比率。此外, 在比格犬的组织 and 血	

浆中, Nepicastat hydrochloride 也会对去甲肾上腺素, 多巴胺和多巴胺/去甲肾上腺素比率产生相似的作用。在仲丁硫巴比妥麻醉的 SHR 体内, Nepicastat hydrochloride (3 mg/kg, i.v.) 产生抗高血压作用, 并显著降低肾脏血管阻力(38%), 增加肾血流量(22%)。在患有慢性心力衰竭的狗体内, 小剂量 Nepicastat hydrochloride (0.5 mg/kg) 防止左心室(LV)功能紊乱和重塑, Nepicastat hydrochloride 和 enalapril 结合治疗在所有使所有形态特征得到额外的改善。在大鼠大脑中, 50 mg/kg (i.p.) 剂量的 Nepicastat hydrochloride 导致去甲肾上腺素(NE)减少, 并阻断可卡因诱导的毒瘾的恢复。

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。Nepicastat(SYN117; RS-25560-197) 盐酸盐是多巴胺_beta_-羟化酶高效抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		3.0138 mL	15.0689 mL	30.1377 mL
5 mM		0.6028 mL	3.0138 mL	6.0275 mL
10 mM		0.3014 mL	1.5069 mL	3.0138 mL
50 mM		0.0603 mL	0.3014 mL	0.6028 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	<p>Animal Models: 自发性高血压大鼠(SHRs)</p> <p>Formulation: Nepicastat hydrochloride 在蒸馏水中溶解。</p> <p>Dosages: ≤100 mg/kg</p> <p>Administration: 口服给药</p>
-------------	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做好预处理, 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。