上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

产品名称：PRE-084 (hydrochloride)
CAS 号：75136-54-8
产品货号：S86412

生物活性：

Description	PRE-084 hydrochloride 是一种高选择性的σ1 受体 (S1R) 激动剂，其 IC50 值为 44 nM。PRE-084 hydrochloride 具有较好的神经保护作用，可改善小鼠的运动功能和运动神经元的存活率。PRE-084 hydrochloride 还能通过激活 Akt-eNOS 途径来改善大鼠心肌缺血再灌注损伤。
IC50 & Target	eNOS　Sigma 1 Receptor
In Vitro	PRE-084 hydrochloride (0.1-100 μM；24 小时) 能保护培养的皮层神经元免受 β-淀粉样蛋白毒性 (在 10 μM 时神经保护作用最强)，并在 10 μM 浓度下降低促凋亡蛋白 Bax 的水平[1]。 Cell Viability Assay[1] Cell Line: Cortical cells (βAP(25-35)-induced neurotoxicity model) Concentration: 0.1-100 μM Incubation Time: 24 h Result: Reduced neuronal toxicity in a bell shaped-manner and is maximally neuroprotective at 10 μM. Western Blot Analysis[1] Cell Line: Cortical cells (βAP(25-35)-induced neurotoxicity model) Concentration: 10 μM Incubation Time: 24 h Result: Reduced the levels of proapoptotic protein Bax in cortical neurons induced by βAP(25-35).
In Vivo	PRE-084 hydrochloride (0.25 mg/kg；腹腔注射；每周 3 次，持续 8 周) 对 wobbler 小鼠的运动功能具有改善作用 (提高运动神经元存活率、改善爪部异常和抓握力表现)，并显示出神经保护效应 (增加灰质中脑源性神经营养因子 BDNF 水平)[2]。 PRE-084 hydrochloride (1 mg/kg；腹腔注射；单次给药) 在心肌梗死模型中通过激活 Akt-eNOS 通路发挥心脏保护作用[3]。 **Animal Model:** Wobbler mice (4-week-old)[2]. **Dosage:** 0.25 mg/kg **Administration:** Intraperitoneal injection; 3 times a week for 8 weeks. **Result:** Significantly improved ameliorated paw abnormality from week 4, and notably impr Reduced the number of reactive astrocytes whereas increased the number of pan-ma CD206+ cells involved in tissue restoration. **Animal Model:** Adult male Sprague- Dawley rats (220-250 g; myocardial infarction model)[3]. **Dosage:** 1 mg/kg **Administration:** Intraperitoneal injection; single. **Result:** Significantly decreased the degree of myocardial apoptosis. Led to significantly increased expression of p- Akt and p- eNOS.
Solvent&Solubility	**细胞实验:** H2O 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (94.18 mM; 超声助溶 (<60°C)) DMSO 中的溶解度 : 17.5 mg/mL (49.45 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

响，请使用新开封的 DMSO)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.8258 mL	14.1291 mL	28.2582 mL
	5 mM	0.5652 mL	2.8258 mL	5.6516 mL
	10 mM	0.2826 mL	1.4129 mL	2.8258 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

* 备注：如您选择水作为储备液，请稀释至工作液后，再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。

动物实验：

请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。

以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用；

以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

方案 一

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.88 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。

生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH_2O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。

方案 二

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.88 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。

2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

方案 三

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.88 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

参考文献

[1]. Marrazzo A, et al. Neuroprotective effects of sigma-1 receptor agonists against beta-amyloid-induced toxicity. Neuroreport. 2005 Aug 1;16(11):1223-6.

[2]. Peviani M, et al. Neuroprotective effects of the Sigma-1 receptor (S1R) agonist PRE-084, in a mouse

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

model of motor neuron disease not linked to SOD1 mutation. Neurobiol Dis. 2014 Feb;62:218-32.

[3]. Gao QJ, et al. Sigma-1 Receptor Stimulation with PRE-084 Ameliorates Myocardial Ischemia-Reperfusion Injury in Rats. Chin Med J (Engl). 2018 Mar 5;131(5):539-543.

[4]. Su TP, et al. Sigma compounds derived from phencyclidine: identification of PRE-084, a new, selective sigma ligand. J Pharmacol Exp Ther. 1991 Nov;259(2):543-50.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO/H2O	**1 mM**	2.8258 mL	14.1291 mL	28.2582 mL	70.6454 mL
	5 mM	0.5652 mL	2.8258 mL	5.6516 mL	14.1291 mL
	10 mM	0.2826 mL	1.4129 mL	2.8258 mL	7.0645 mL
	15 mM	0.1884 mL	0.9419 mL	1.8839 mL	4.7097 mL
	20 mM	0.1413 mL	0.7065 mL	1.4129 mL	3.5323 mL
	25 mM	0.1130 mL	0.5652 mL	1.1303 mL	2.8258 mL
	30 mM	0.0942 mL	0.4710 mL	0.9419 mL	2.3548 mL
	40 mM	0.0706 mL	0.3532 mL	0.7065 mL	1.7661 mL
H2O	**50 mM**	0.0565 mL	0.2826 mL	0.5652 mL	1.4129 mL
	60 mM	0.0471 mL	0.2355 mL	0.4710 mL	1.1774 mL
	80 mM	0.0353 mL	0.1766 mL	0.3532 mL	0.8831 mL

备注：如您选择水作为储备液，请稀释至工作液后，再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。