



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: shyyssw@sina.com

产品名称: NS3861 fumarate

CAS 号: 216853-60-0

产品货号: S89824

生物活性:

Description	NS3861 fumarate is an agonist of nicotinic acetylcholine receptors (nAChRs) and binds with high affinity to heteromeric α3β4 nAChR. The binding Ki values of 0.62, 25, 7.8, 55 nM for α3β4, α3β2, α4β4, α4β2, respectively[1].				
In Vitro	NS3861 fumarate displays the opposite β-subunit preference and a complete lack of activation at α4-containing receptors in HEK293 cell lines. NS3861 fumarate selectively activates α3- but not α4-containing nAChRs and it displays higher efficacy at the α3β2 receptor compared with the α3β4 receptor, with EC50s of 1.7 and 0.15 μM for α3β2 and α3β4 receptor, respectively[1]. NS3861 fumarate shows high affinity and partial agonist properties in α3β4-expressed nAChRs[2].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (249.82 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.4982 mL	12.4909 mL	24.9819 mL
		5 mM	0.4996 mL	2.4982 mL	4.9964 mL
		10 mM	0.2498 mL	1.2491 mL	2.4982 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 and light)。-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。 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 ddH₂ O 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 25.0 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]. Kasper Harpsøe, et al. Molecular determinants of subtype-selective efficacies of cytisine and the novel compound NS3861 at heteromeric nicotinic acetylcholine receptors. J Biol Chem. 2013 Jan 25;288(4):2559-70.

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 and light)。-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	1 mM	2.4982 mL	12.4909 mL	24.9819 mL	62.4547 mL
	5 mM	0.4996 mL	2.4982 mL	4.9964 mL	12.4909 mL
	10 mM	0.2498 mL	1.2491 mL	2.4982 mL	6.2455 mL
	15 mM	0.1665 mL	0.8327 mL	1.6655 mL	4.1636 mL
	20 mM	0.1249 mL	0.6245 mL	1.2491 mL	3.1227 mL
	25 mM	0.0999 mL	0.4996 mL	0.9993 mL	2.4982 mL
	30 mM	0.0833 mL	0.4164 mL	0.8327 mL	2.0818 mL
	40 mM	0.0625 mL	0.3123 mL	0.6245 mL	1.5614 mL
	50 mM	0.0500 mL	0.2498 mL	0.4996 mL	1.2491 mL
	60 mM	0.0416 mL	0.2082 mL	0.4164 mL	1.0409 mL
	80 mM	0.0312 mL	0.1561 mL	0.3123 mL	0.7807 mL
	100 mM	0.0250 mL	0.1249 mL	0.2498 mL	0.6245 mL