



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **SR59230A**
CAS 号: **174689-39-5**
产品货号: **S89990**

生物活性:					
Description	SR59230A is a potent, selective, and blood-brain barrier penetrating β 3-adrenergic receptor antagonist[1] with IC50s of 40, 408, and 648 nM for β 3, β 1, and β 2 receptors, respectively[2].				
IC50 & Target	β adrenergic receptor				
In Vitro	SR59230A (100 nM-50 μM; 24 小时)能够以剂量依赖性方式降低 Neuro-2A、BE(2)C 和 SK-N-BE(2) NB 细胞系中的细胞活力[3]。 Cell Line: Three different neuroblastoma (NB) cell lines, one murine (Neuro-2A) and two human (SK-N-BE(2), BE(2)C) Concentration: 100 nM, 1 μM, 5 μM, 10 μM, and 50 μM Incubation Time: 24 hours Result: Reduced cell viability in a dose-dependent manner, with significant effect at a concentration limit over 1 μM for Neuro-2A cells and 5 μM for SK-N-BE(2) and BE(2)C).				
In Vivo	MDMA (20 mg/kg) 产生缓慢发展的高热, 在注射后 130 分钟达到最大升高 1.8 $^{\circ}$C。SR59230A (0.5 mg/kg) 对 MDMA 产生的缓慢发展的高热有轻微但显著的衰减。SR59230A (5 mg/kg) 对 MDMA 产生显著且明显的早期降温反应[4]。 Animal Model: Male C-57BL6J wild-type mice (22-35 g)[4] Dosage: 0.5 or 5 mg/kg Administration: Injected s.c.; administered 30 min prior to the injection s.c. of MDMA (20 mg/kg). Result: Modulated the actions of MDMA on temperature involve α1-adrenoceptor antagonism.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (300.86 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	2.4069 mL	12.0343 mL	24.0685 mL
		5 mM	0.4814 mL	2.4069 mL	4.8137 mL
		10 mM	0.2407 mL	1.2034 mL	2.4069 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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
	动物实验:				
	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline				
Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (5.01 mM); 澄清溶液					
此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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 $_2$ 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.01 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 (5.01 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]. Nisoli E, et al. Functional studies of the first selective beta 3-adrenergic receptor antagonist SR 59230A in rat brown adipocytes. Mol Pharmacol. 1996 Jan;49(1):7-14. [2]. Kanzler SA, et al. Involvement of β3-adrenergic receptors in the control of food intake in rats. Braz J Med Biol Res. 2011 Nov;44(11):1141-7. [3]. Bruno G, et al. β3-adrenoreceptor blockade reduces tumor growth and increases neuronal differentiation in neuroblastoma via SK2/S1P2 modulation. Oncogene. 2020 Jan;39(2):368-384. [4]. Bexis S, et al. Role of alpha 1- and beta 3-adrenoceptors in the modulation by SR59230A of the effects of MDMA on body temperature in the mouse. Br J Pharmacol. 2009 Sep;158(1):259-66.

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	1 mM	2.4069 mL	12.0343 mL	24.0685 mL	60.1714 mL
	5 mM	0.4814 mL	2.4069 mL	4.8137 mL	12.0343 mL
	10 mM	0.2407 mL	1.2034 mL	2.4069 mL	6.0171 mL
	15 mM	0.1605 mL	0.8023 mL	1.6046 mL	4.0114 mL
	20 mM	0.1203 mL	0.6017 mL	1.2034 mL	3.0086 mL
	25 mM	0.0963 mL	0.4814 mL	0.9627 mL	2.4069 mL
	30 mM	0.0802 mL	0.4011 mL	0.8023 mL	2.0057 mL
	40 mM	0.0602 mL	0.3009 mL	0.6017 mL	1.5043 mL
	50 mM	0.0481 mL	0.2407 mL	0.4814 mL	1.2034 mL



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

	60 mM	0.0401 mL	0.2006 mL	0.4011 mL	1.0029 mL
	80 mM	0.0301 mL	0.1504 mL	0.3009 mL	0.7521 mL
	100 mM	0.0241 mL	0.1203 mL	0.2407 mL	0.6017 mL



源叶