



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: **SYM 2081**

CAS 号: **31137-74-3**

产品货号: **T74001**

生物活性:						
Description	SYM 2081 is a kainate receptor agonist. SYM 2081 is a substrate of EAAT1 (Km of 54 μM). SYM 2081 inhibits EAAT2-mediated glutamate transport (Kb is 3.4 μM in Xenopus oocytes), modulates Apoptotic signaling pathways (increases Bcl-2 and decreases Bax/caspase-3 expression). SYM 2081 exhibits neuroprotective activity. SYM 2081 can be used in the study of hypoxic-ischemic brain damage and inflammatory or neuropathic pain[1][2][3][4].					
IC50 & Target	Kainate Receptor	Caspase-3	Bax	Bcl-2	EAAT1 54 μM (Km)	EAAT2
In Vitro	SYM 2081 可通过在非洲爪蟾卵母细胞中表达的 EAAT1 进行转运, 其 Km 为 54 μM, 可强效阻断通过 EAAT2 进行的谷氨酸转运, 其 Kb 为 3.4 μM[2]。 SYM 2081 (10 μg/mL; 16 h) 在缺氧条件下可增加培养的胚胎皮层神经元细胞中的 Bcl-2 表达, 并降低 Bax/caspase-3 表达和 Bax/Bcl-2 比率[4]。					
In Vivo	SYM 2081 (10-100 mg/kg; 腹腔注射; 在 Capsaicin 之前) 可减轻 Capsaicin 引起的大鼠机械和热痛觉过敏[3]。 SYM 2081 (10 mg/kg; 腹腔注射; 缺氧暴露前 30 min) 通过增加 Bcl-2 表达、降低 Bax/caspase-3 表达和 Bax/Bcl-2 比率来减少新生大鼠缺氧缺血性脑细胞凋亡[4]。					
	Animal Model:	Adult male Sprague-Dawley rats (250-300 g); intraplantar capsaicin injection or Carrageenan injection[3]				
	Dosage:	10, 50, 100 mg/kg for Capsaicin model; 10, 100 mg/kg (saline) for Carrageenan model				
	Administration:	i.p. injection once, 30 min before capsaicin or 2.5 h after carrageenan				
	Result:	Reduced mechanical withdrawal frequency and prolonged heat withdrawal latency at 100 mg/kg (capsaicin model). Completely reversed mechanical hyperalgesia and partially reversed heat hyperalgesia, with effects lasting 2.5 h and 5.5 h, respectively (Carrageenan model).				
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 50 mg/mL (310.25 mM); 超声助溶					
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	6.2050 mL	31.0251 mL	62.0501 mL	
		5 mM	1.2410 mL	6.2050 mL	12.4100 mL	
		10 mM	0.6205 mL	3.1025 mL	6.2050 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。 -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。						
参考文献	[1]. Lee JY, et al. Furthering pharmacological and physiological assessment of the glutamatergic receptors at the Drosophila neuromuscular junction. Comp Biochem Physiol C Toxicol Pharmacol. 2009 Nov;150(4):546-57.					



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: shyyw@sina.com

- [2]. Vandenberg RJ, et al. Contrasting modes of action of methylglutamate derivatives on the excitatory amino acid transporters, EAAT1 and EAAT2. Mol Pharmacol. 1997 May;51(5):809-15.
- [3]. Turner MS, et al. SYM 2081, an agonist that desensitizes kainate receptors, attenuates capsaicin and inflammatory hyperalgesia. Brain Res. 2003 May 30;973(2):252-64.
- [4]. Park J K, et al. SYM 2081 Exerts Neuroprotective Effect Modulating Anti-Apoptosis in the Hypoxic-Ischemic Brain Injury of Neonatal Rats[J]. Perinatology, 2019, 30(3): 117-125.

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。-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
H ₂ O	1 mM	6.2050 mL	31.0251 mL	62.0501 mL	155.1253 mL
	5 mM	1.2410 mL	6.2050 mL	12.4100 mL	31.0251 mL
	10 mM	0.6205 mL	3.1025 mL	6.2050 mL	15.5125 mL
	15 mM	0.4137 mL	2.0683 mL	4.1367 mL	10.3417 mL
	20 mM	0.3103 mL	1.5513 mL	3.1025 mL	7.7563 mL
	25 mM	0.2482 mL	1.2410 mL	2.4820 mL	6.2050 mL
	30 mM	0.2068 mL	1.0342 mL	2.0683 mL	5.1708 mL
	40 mM	0.1551 mL	0.7756 mL	1.5513 mL	3.8781 mL
	50 mM	0.1241 mL	0.6205 mL	1.2410 mL	3.1025 mL
	60 mM	0.1034 mL	0.5171 mL	1.0342 mL	2.5854 mL
	80 mM	0.0776 mL	0.3878 mL	0.7756 mL	1.9391 mL
	100 mM	0.0621 mL	0.3103 mL	0.6205 mL	1.5513 mL