

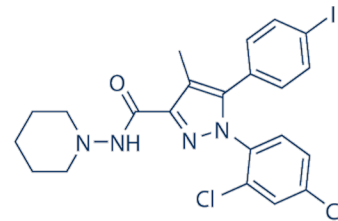
## AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2375-10mM	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2375-5mg	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	5mg
SD2375-25mg	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	1-(2,4-dichlorophenyl)-5-(4-iodophenyl)-4-methyl-N-piperidin-1-ylpyrazole-3-carboxamide
简称	AM251
别名	AM 251, AM-251
中文名	N/A
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> Cl <sub>2</sub> IN <sub>4</sub> O
分子量	555.24
CAS号	183232-66-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 40mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.90ml DMSO, 或每5.55mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD2375-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	AM251是大麻素CB1受体拮抗剂, IC <sub>50</sub> 为700nM, 在体内与小鼠脑CB1受体结合。				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	CB1	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	—	—	—	—	—
体外研究	AM251减少藜芦定依赖性(河豚毒素抑制性)L-谷氨酸和GABA从突触体的释放, IC <sub>50</sub> 分别为8.5μM和9.2μM。AM251增加(2.3倍)放射性配体的K <sub>d</sub> , 而不改变B <sub>max</sub> 。AM251通过变构性加速[ <sup>3</sup> H]-箭毒蛙毒素A 20-α-苯甲酸盐: 钠离子通道复合物的解离, 抑制平衡结合。AM251减少未刺激的和乙酰化LDL-刺激的Raw 264.7巨噬细胞, CB2+/+和CB2-/-腹膜巨噬细胞中胆固醇酯的合成。				
体内研究	AM251引起大鼠每日摄食量持续减少。AM251引起大鼠挑食和与恶心相关的行为, 但是不影响摄食率。AM251干扰抑制逃避任务中记忆的巩固。与对照组相比, AM251引起测试的潜伏期有效减少, 但是在开放的户外适应性任务中没有检测到差异, 包括交叉口的数量, 即没有本质影响。以新的环境进行的条件语气提示期间, AM251(4.0mg/kg)减少凝固。				
临床实验	N/A				
特征	一种选择性大麻素1阻滞剂。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	巨噬细胞接种(2×10 <sup>6</sup> /孔)在12孔培养板。从2mg/ml乙醇储备液中加入7-酮基胆固醇之前1小时, 加入DMSO中制备的4mM AM-25储备液。调节对照组, 达到等体积的DMSO和乙醇。16小时后, 测定caspase-3的活性。所有处理重复3次进行, 数据以平均RFLU/mg蛋白质表示。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验
------

动物模型	适度肥胖的雄性Lewis大鼠
配制	2%二甲基亚砷, 1% Tween 80和97%生理盐水
剂量	1.25mg/kg, 2.5mg/kg和5mg/kg
给药方式	i.p.

➤ **参考文献:**

- 1.Liao C, et al. Basic Clin Pharmacol Toxicol, 2004, 94(2), 73-78.
- 2.Thewke D, et al. Biochem Biophys Res Commun, 2009, 381(2), 181-186.
- 3.Chambers AP, et al. Physiol Behav, 2004, 82(5), 863-869.
- 4.McLaughlin PJ, et al. Psychopharmacology (Berl), 2005, 180(2), 286-293.
- 5.de Oliveira Alvares L, et al. Neurobiol Learn Mem, 2005, 83(2), 119-124.
- 6.de Oliveira Alvares L, et al. Brain Res, 2006, 1075(1), 60-67.
- 7.Sink KS, et al. Pharmacol Biochem Behav, 2010, 95(4), 479-484.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD2375-10mM	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2375-5mg	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	5mg
SD2375-25mg	AM251 (Cannabinoid Receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01