

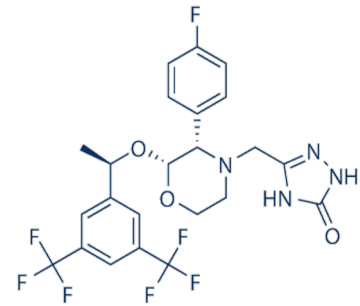
Aprepitant (Substance P拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1091-10mM	Aprepitant (Substance P拮抗剂)	10mM×0.2ml
SF1091-5mg	Aprepitant (Substance P拮抗剂)	5mg
SF1091-25mg	Aprepitant (Substance P拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-[[[(2R,3S)-2-[(1R)-1-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]ethoxy]-3-(4-fluorophenyl)morpholin-4-yl]methyl]-1,2-dihydro-1,2,4-triazol-3-one
简称	Aprepitant
别名	MK-0869, Emend, L 754030, L-754030, MK 0517, MK 0869, MK 869, MK-0517, MK-869, MK0517
中文名	阿瑞匹坦
化学式	C ₂₃ H ₂₁ F ₇ N ₄ O ₃
分子量	534.43
CAS号	170729-80-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 107mg/ml; Ethanol 15mg/ml
溶液配制	5mg加入0.94ml DMSO, 或每5.34mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF1091-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Aprepitant是一种有效的选择性neurokinin-1 receptor拮抗剂。				
信号通路	Others				
靶点	Neurokinin-1 receptor	—	—	—	—
IC50	0.1nM	—	—	—	—
体外研究	Aprepitant通过结合CNS和外周的NK-1受体而拮抗P物质的作用。Aprepitant, 在0.1nM浓度下从CHO或COS细胞中hNK1受体上取代50%的P物质。在放射性配体结合试验中, Aprepitant对人类无性繁殖的NK1受体的选择性是人类无性繁殖的NK3受体的3000倍, 比人类无性繁殖的NK2受体多出50000倍。在一系列其他人类无性繁殖的G蛋白偶联受体试验中, Aprepitant对人类无性繁殖的NK1受体保持>50000倍的选择性。在人类单胺氧化酶A和B试验以及人类血清素5-HT1A、5-HT2A、5-HT2c、5-HT3、5-HT5、5-HT6和5-HT7受体(IC50>3μM)中, Aprepitant是没有活性的。在放射性配体结合筛选的PANLABS板中, 采用原生动组织, Aprepitant抑制大鼠颌下腺中[3H]P物质与天然NK1受体结合; 通过检查PANLABS筛选, Aprepitant与其他任何原生动G蛋白耦合的受体或离子通道都没有明显的相互作用。在使用人类和动物组织(IC50>3μM)进行的单胺摄取位点(NE, 5-HT, DA)计数筛选中, Aprepitant是没有活性的。				
体内研究	Aprepitant能够穿过血脑屏障并占据大脑中NK-1受体。Aprepitant能够抑制细胞毒性化疗, 比如阻断P物质的顺铂诱发的急性和延迟性呕吐。Aprepitant(3mg/kg i.v. or p.o.)抑制顺铂(10mg/kg i.v.)引起的呕吐。Aprepitant(0.1mg/kg i.v.)与dexamethasone(20mg/kg i.v.)或5-HT3受体拮抗剂ondansetron(0.1mg/kg i.v.)联用能够加强止吐作用。在一个急性迟缓性呕吐模型中, 雪貂被给予cisplatin(5mg/kg i.p.), 恶心并呕吐的回应记录为72小时。Aprepitant(4–16mg/kg p.o.)剂量依赖性预处理抑制cisplatin引起的呕吐。每天一次的Aprepitant(2 and 4mg/kg p.o.)治疗完全阻止了所有测试雪貂的恶心和呕吐症状。Cisplatin注射24小时后, 呕吐急性期已经建立, 开始每天给药, Aprepitant(4mg/kg p.o. cisplatin注射后24和48h)抑制了四分之三雪貂的恶心和呕吐症状。在疼痛冲动从外周受体到CNS的传感中, Aprepitant也起着关键作用, 它也参与对压力的各种行为, 神经化学和心血管的反应。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	N/A

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	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

- 1.Tattersall FD, et al. Neuropharmacology, 2000, 39(4), 652-663.
- 2.Navari RM. Expert Rev Anticancer Ther, 2004, 4(5), 715-724.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF1091-10mM	Aprepitant (Substance P拮抗剂)	10mM×0.2ml
SF1091-5mg	Aprepitant (Substance P拮抗剂)	5mg
SF1091-25mg	Aprepitant (Substance P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