

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	B10016
产品名称:	苄丝肼 盐酸盐

产品简介:

一种芳香族 L-氨基酸脱羧酶 (AADC) 和 L-多巴脱羧酶 (L-DOPA decarboxylase) 的抑制剂。Benserazide hydrochloride 也是 PKM2 的抑制剂。Benserazide hydrochloride 直接结合并阻断 PKM2 酶活性, 从而抑制有氧糖酵解, 同时上调 OXPHOS 的活性。Benserazide hydrochloride 可用于帕金森病和黑色素瘤的研究。

体外研究:

Benserazide hydrochloride (BH) 和 左旋多巴(LD) 单独使用或联合使用 (Benserazide hydrochloride + 左旋多巴) (25 μ M; 0 小时、12 小时、24 小时和 168 小时; SH-SY5Y) 治疗可抑制蛋白质聚集, 并能够最大限度地降低淀粉样蛋白在人神经母细胞瘤细胞系中诱导的细胞毒性。Benserazide hydrochloride 和 LD 均可有效抑制细胞毒性 HSA 聚集体的形成, 同时加入这两种药物时抑制效果更明显。

体内研究:

Benserazide (5-50 mg/kg; 腹腔内注射; 雄性 Wistar 大鼠) 治疗 6-OHDA 损伤大鼠后, 外源性 L-DOPA 来源的细胞外 DA 水平升高, Benserazide 剂量依赖性地延长 DA 达到峰值的时间。失神经支配纹状体组织中的 AADC 活性在 10 mg/kg 和 50 mg/kg Benserazide 作用下明显降低。Benserazide 降低黑质纹状体失神经支配大鼠纹状体中枢 AADC 活性, 导致外源性 L-DOPA 代谢改变。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

溶于水 (10mg/mg)、DMSO 和甲醇, 不溶于乙醇和丙酮。

浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
1 mM		3.4048 mL	17.0242 mL	34.0483 mL
5 mM		0.6810 mL	3.4048 mL	6.8097 mL
10 mM		0.3405 mL	1.7024 mL	3.4048 mL

储备液的保存方式: -80°C , 1 year; -20°C , 6 months (sealed storage, away from moisture)。

二: 体内实验

1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline

Solubility: $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (7.08 mM); 澄清溶液

此方案可获得 $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (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 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。

2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (7.08 mM); 澄清溶液

此方案可获得 $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (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。

3、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.08 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂: PBS

Solubility: 100 mg/mL (340.48 mM); 澄清溶液; 超声助溶

注: 工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

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。

三、细胞实验

Cell Line:	SH-SY5Y cells
Concentration:	25 μ M
Incubation Time:	0 hour, 12 hours, 24 hours and 168 hours
Result:	Enhanced cell viability, and inhibited the formation of cytotoxic human serum albumin (HSA) aggregates.

四、动物实验

Animal Model:	Male Wistar rats with 6-hydroxydopamine (6-OHDA) (8 Ag/4 Al)
Dosage:	5 mg/kg, 10 mg/kg or 50 mg/kg (Pharmacokinetic study)
Administration:	Intraperitoneal injection
Result:	Increased in exogenous L-DOPA-derived extracellular DA levels, the time to reach the peak DA levels were significantly prolonged in a dose-dependent fashion. The AADC activity in the denervated striatal tissues showed a significant decreased by 10 mg/kg and 50 mg/kg.

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: 室温 避光 干燥

