

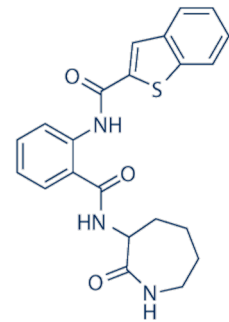
## ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5332-10mM	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SF5332-5mg	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	5mg
SF5332-25mg	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-[2-[(2-oxoazepan-3-yl)carbamoyl]phenyl]-1-benzothiophene-2-carboxamide
简称	ANA-12
别名	ANA 12, AC1ME2YP, Maybridge1_001394, Oprea1_341312
中文名	N/A
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S
分子量	407.49
CAS号	219766-25-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 37mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.23ml DMSO, 或每4.07mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5332-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	ANA-12是一种选择性TrkB拮抗剂, 对高亲和位点和低亲和位点的Kd分别为10nM和12μM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase				
靶点	TrkB	—	—	—	—
IC50	10nM(Kd)	—	—	—	—
体外研究	ANA-12可选择性直接与TrkB受体结合, 抑制TrkB下游通路, 而不改变TrkA和TrkC功能。在nnc5 PC12-TrkB细胞中, 10nM的ANA-12可防止脑源性神经营养因子(BDNF)介导的神经突增生。在DRG神经元中, ANA-12可消除BDNF增加内向电流的作用。				
体内研究	在成年C57BL/6J129SvEv F1s小鼠中, ANA-12(0.5毫克/千克, 腹腔注射)降低脑部TrkB活性, 减轻焦虑和抑郁相关行为, 而不影响神经元的存活。在雄性C57BL/6小鼠体内, ANA-12(0.5毫克/千克, 腹腔注射)对脂多糖诱导的抑郁行为显示出抗抑郁作用。在雄性Sprague-Dawley大鼠中, ANA-12(3微克/剂)阻断孤束内侧亚核(mNTS)BDNF减少进食的作用。在雄性野生型小鼠中, ANA-12逆转酒精摄入, 下调D3受体表达, 但在D3R-/-型小鼠中是无效的。在雄性CocSired大鼠, 腹腔注射ANA-12(0.5 毫克/千克)逆转减弱的可卡因自身给药。				
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	Maxisorp ELISA 96孔板用不同浓度的Trk BECD -Fc, 20毫克/毫升BSA或1毫克/毫升IgG-Fc(多克隆抗-TrkB)的磷酸盐缓冲液(pH 9.6)包被, 在4℃培养过夜。孔板填充0.5% BSA的PBS溶液, 在室温下培养2小时, 用0.05% PBS-Tween充分洗涤。然后Bodipy-ANA-12在0.5% PBS-BSA中于室温下培养1小时, 再加入BDNF的0.5% PBS-BSA溶液, 继续孵育1小时。0.05% PBS-Tween充分洗涤, bodipy-ANA-12结合的数量通过测量520±10nm处的荧光值确定。外推分析的检测范围由bodipy-ANA-12包被的ELISA评估, 读取520±10nm处荧光值。

#### 细胞实验

细胞系	nnr5 PC12-TrkA, nnr5 PC12-TrkB和nnr5 PC12-TrkC细胞
浓度	~100 $\mu$ M
处理时间	~3天
方法	分别经BDNF(1nM)、NGF(2nM)和NT-3(10nM)处理后的nnr5 PC12-TrkB、-TrkA和-TrkC细胞用于分子对神经突增生调节的评估。每个计数区域中, 突触长度大于2倍细胞直径的细胞的数量通过显微镜观察(每孔两个视野, 每组三孔)测定。每24h计数一次, 进行三天。

动物实验	
动物模型	成年C57BL6/129SveV F1s小鼠
配制	1% DMSO溶解于0.9% NaCl溶液
剂量	0.5毫克/千克
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Cazorla M, et al. J Clin Invest. 2011, 121(5), 1846-1857.
- 2.Chen W, et al. Eur J Neurosci. 2014, 39(9), 1439-1454.
- 3.Zhang JC, et al. Int J Neuropsychopharmacol. 2015, 18(4), 1-12
- 4.Spaeth A, et al. Am J Physiol Endocrinol Metab. 2012, 302(10), 1252-1260.
- 5.Leggio GM, et al. Neuropsychopharmacology. 2014, 39(8), 2017-2028.
- 6.Vassoler FM, et al. Nat Neurosci. 2013, 16(1), 42-47.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF5332-10mM	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SF5332-5mg	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	5mg
SF5332-25mg	ANA-12 (Trk receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效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