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：shyysw@sina.com

产品名称：L-655,708
产品别名：L-655708

生物活性：

Description

L-655708 is a potent α5 subunit-selective GABAA receptor inverse agonist (Ki = 0.45 nM). IC50: 0.45 nM (Ki) Target: GABA in vitro: L-655708 is a potent, selective inverse agonist for the benzodiazepine site of GABAA receptors containing the α5 subunit (Ki = 0.45 nM). Displays 50-100-fold selectivity over GABAA receptors containing α1, α2, α3 orα6 subunits in combination with β3 and γ2. Enhances LTP in a mouse hippocampal slice model and increases spatial learning, without displaying proconvulsant activity. in vivo: L-655708 at 0.7 mg/kg, administered intraperitoneally, would result in 60-70% occupancy of α5 GABAA receptors with limited binding to α1, α2, and α3 subunit-containing GABAA receptors and no significant off-target behavioral effects, such as sedation and motor impairment.[1]

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 20 mg/mL (**58.59 mM;** Need ultrasonic)

H_2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.9295 mL	14.6473 mL	29.2946 mL
	5 mM	0.5859 mL	2.9295 mL	5.8589 mL
	10 mM	0.2929 mL	1.4647 mL	2.9295 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。

In Vivo:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2 mg/mL (5.86 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2 mg/mL (5.86 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

References

[1]. Saab BJ, et al. Short-term memory impairment after isoflurane in mice is prevented by the α5 γ-aminobutyric acid type A receptorinverse agonist L-655708. Anesthesiology. 2010 Nov;113(5):1061-1071.