



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **ARM390 HCl**
CAS 号: **209808-47-9**
产品货号: **S29691**

生物活性:

Description	AR-M 1000390 hydrochloride 是一种有效的选择性 δ 阿片受体激动剂, EC50 为 7.2±0.9 nM.																	
IC50 & Target	δ Opioid Receptor/DOR																	
In Vitro	AR-M 1000390 (Compound 6a) hydrochloride 对 δ 阿片受体的结合亲和力 (IC50) 为 0.87 nM, 对 μ 受体 (IC50) 具有极高的选择性 $\geq$ 3800 nM) 和 κ 受体 (IC50=7470 nM)[1]。在测量细胞内和分泌的胰岛素水平之前, 用 AR-M 1000390 hydrochloride 和 Cyclizine 处理 RINm5F 细胞 16-24 小时。AR-M 1000390 介导胰岛素含量的剂量依赖性降低, 在测试的最高浓度 (10 μ M) 下最大抑制约为 90%[2]。																	
In Vivo	大鼠用 5、100 和 600 μ Mol/kg 的 AR-M 1000390 (AR-M100390) hydrochloride 处理 3 和/或 7 天; 另一组用 600 μ Mol/kg 化合物处理的大鼠被允许恢复 14 天。AR-M 1000390 (600 μ Mol/kg) hydrochloride 在大鼠胰腺的 β 细胞中引起空泡形成, 这与给药 7 天后胰岛素耗尽和高血糖有关。用 600 μ Mol/kg 的 AR-M 1000390 hydrochloride 处理大鼠导致大鼠胰腺 β 细胞空泡化, 这与报道的 cyclizine 和赛庚啶 相似[2]。																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 150 mg/mL (389.67 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : 50 mg/mL (129.89 mM; 超声助溶) * "≥" means soluble, but saturation unknown <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent Mass Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.5978 mL</td><td>12.9890 mL</td><td>25.9781 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.5196 mL</td><td>2.5978 mL</td><td>5.1956 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2598 mL</td><td>1.2989 mL</td><td>2.5978 mL</td></tr></table> *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 (sealed storage, away from moisture)。-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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。 动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.5978 mL	12.9890 mL	25.9781 mL	5 mM	0.5196 mL	2.5978 mL	5.1956 mL	10 mM	0.2598 mL	1.2989 mL	2.5978 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		2.5978 mL	12.9890 mL	25.9781 mL													
	5 mM		0.5196 mL	2.5978 mL	5.1956 mL													
	10 mM	0.2598 mL	1.2989 mL	2.5978 mL														



	合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Wei ZY, et al. N,N-Diethyl-4-(phenylpiperidin-4-ylidenemethyl)benzamide: a novel, exceptionally selective, potent delta opioid receptor agonist with oral bioavailability and its analogues. J Med Chem. 2000 Oct 19;43(21):3895-905. [2]. Otieno MA, et al. Mechanistic investigation of N,N-diethyl-4-(phenyl-piperidin-4-ylidenemethyl)-benzamide-induced insulin depletion in the rat and RINm5F cells. Toxicol Sci. 2008 Sep;105(1):221-9.

完整储备液配制表:

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 (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO/H ₂ O	1 mM	2.5978 mL	12.9890 mL	25.9781 mL	64.9452 mL
	5 mM	0.5196 mL	2.5978 mL	5.1956 mL	12.9890 mL
	10 mM	0.2598 mL	1.2989 mL	2.5978 mL	6.4945 mL
	15 mM	0.1732 mL	0.8659 mL	1.7319 mL	4.3297 mL
	20 mM	0.1299 mL	0.6495 mL	1.2989 mL	3.2473 mL
	25 mM	0.1039 mL	0.5196 mL	1.0391 mL	2.5978 mL
	30 mM	0.0866 mL	0.4330 mL	0.8659 mL	2.1648 mL
	40 mM	0.0649 mL	0.3247 mL	0.6495 mL	1.6236 mL



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

	50 mM	0.0520 mL	0.2598 mL	0.5196 mL	1.2989 mL
	60 mM	0.0433 mL	0.2165 mL	0.4330 mL	1.0824 mL
	80 mM	0.0325 mL	0.1624 mL	0.3247 mL	0.8118 mL
	100 mM	0.0260 mL	0.1299 mL	0.2598 mL	0.6495 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶