



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: **LP-211**
CAS 号: **1052147-86-0**
产品货号: **S87644**

生物活性:

Description	LP-211 是一种选择性的,可透过血脑屏障的 5-HT7 受体激动剂, Ki 值为 0.58 nM, 选择性高于 5-HT1A 受体 (Ki, 188 nM) 和 D2 受体 (Ki, 142 nM)。				
IC50 & Target	5-HT _{1A} Receptor	5-HT ₇ Receptor	5-HT ₇ Receptor	5-HT _{1A} Receptor	
			0.58 nM (Ki)	188 nM (Ki)	
In Vitro	LP-211 是一种选择性 5-HT7 受体激动剂,其 Ki 为 0.58 nM,比 5-HT1A 受体 (Ki, 188 nM) 和 D2 受体 (Ki, 142 nM) 的选择性分别高出 324 倍和 245 倍。LP-211 显示出激动剂特性,其 EC50 值为 0.6 μM[1]。				
In Vivo	LP-211 (10 mg/kg, ip) 迅速到达小鼠体循环, 30 分钟时平均 Cmax 为 0.76 ± 0.32 μg/mL[1]。				
	LP-211 (0.003-0.3 mg/kg, ip) 以剂量依赖的方式显著增加排尿量, 并导致脊髓损伤 (SCI) 大鼠的排尿效率显著增加, 这种作用可以通过以下方式完全逆转 SB-269970[2]。				
	LP-211 (0.25 和 0.50 mg/kg ip) 改善大鼠腔室形状记忆的巩固, 导致显著的新奇物诱导的多动和识别[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (214.31 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Ethanol 中的溶解度 : 50 mg/mL (107.15 mM; 超声助溶)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1431 mL	10.7154 mL	21.4307 mL
		5 mM	0.4286 mL	2.1431 mL	4.2861 mL
		10 mM	0.2143 mL	1.0715 mL	2.1431 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。				
	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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.36 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。					



	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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.36 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 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.36 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, 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Leopoldo M, et al. Structural modifications of N-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-4-aryl-1-piperazinehexanamides: influence on lipophilicity and 5-HT₇ receptor activity. Part III. J Med Chem. 2008 Sep 25;51(18):5813-22. [2]. Norouzi-Javidan A, et al. Effect of 5-HT₇ receptor agonist, LP-211, on micturition following spinal cord injury in male rats. Am J Transl Res. 2016 Jun 15;8(6):2525-33. eCollection 2016. [3]. Beaudet G, et al. LP-211, a selective 5-HT₇ receptor agonist, increases novelty-preference and promotes risk-prone behavior in rats. Synapse. 2017 Dec;71(12).

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。-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/Ethanol	1 mM	2.1431 mL	10.7154 mL	21.4307 mL	53.5768 mL
	5 mM	0.4286 mL	2.1431 mL	4.2861 mL	10.7154 mL
	10 mM	0.2143 mL	1.0715 mL	2.1431 mL	5.3577 mL
	15 mM	0.1429 mL	0.7144 mL	1.4287 mL	3.5718 mL
	20 mM	0.1072 mL	0.5358 mL	1.0715 mL	2.6788 mL
	25 mM	0.0857 mL	0.4286 mL	0.8572 mL	2.1431 mL
	30 mM	0.0714 mL	0.3572 mL	0.7144 mL	1.7859 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

	40 mM	0.0536 mL	0.2679 mL	0.5358 mL	1.3394 mL
	50 mM	0.0429 mL	0.2143 mL	0.4286 mL	1.0715 mL
	60 mM	0.0357 mL	0.1786 mL	0.3572 mL	0.8929 mL
	80 mM	0.0268 mL	0.1339 mL	0.2679 mL	0.6697 mL
	100 mM	0.0214 mL	0.1072 mL	0.2143 mL	0.5358 mL



源叶