



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: **GIBH-130**
CAS 号: **1252608-59-5**
产品货号: **S87721**

生物活性:					
Description	GIBH-130 是有效的神经炎症抑制剂。GIBH-130 作用于活化的小胶质细胞, 显著抑制 IL-1 β 分泌, IC50 为 3.4 nM。				
IC50 & Target[1]	IL-1β 3.4 nM (IC50)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	BV-2	IC50	3.4 nM	Antiinflammatory activity in LPS-stimulated mouse BV-2 cells assessed as inhibition of IL-1beta release at 10 uM and measured after 8 hrs by ELISA	
In Vitro	GIBH-130 是一种新型抗神经炎症剂, 通过基于小胶质细胞的表型筛选鉴定。GIBH-130 (IC50 3.4 nM) 在筛选中被确定为半衰期可接受的最有效抑制剂之一。用 GIBH-130 预处理小胶质细胞可显著减少这些因子对脂多糖 (LPS) 刺激的反应, 减少的程度取决于 GIBH-130 的浓度。GIBH-130 抑制 NO 和 TNF- α 的 IC50 值分别为 46.24 和 40.82 μM。值得注意的是, 用 GIBH-130 预处理可显著抑制活化小胶质细胞分泌 IL-1 β (IC50=3.4 nM)。20 nM GIBH-130 的抑制效率与 20 μM 米诺环素对 IL-1 β 释放的抑制效率相当。IL-1 β 是 AD 神经炎症进展过程中的主要细胞因子之一。因此, 解释 GIBH-130 对 IL-1 β (IC50 值 3.4 nM) 相对于 NO 和 TNF- α (IC50 值 46.24 和分别为 40.82 μM)[1]。				
In Vivo	GIBH-130 在 β 淀粉样蛋白诱导和 APP/PS1 双转基因阿尔茨海默氏症小鼠模型中以显著较低的剂量 (0.25 mg/kg) 分别表现出与多奈哌齐和美金刚在认知障碍缓解方面相当的体内疗效。GIBH-130 的药代动力学特性在 Sprague-Dawley 大鼠中进行了评估。作为靶向中枢神经系统的潜在候选药物, GIBH-130 被发现在大鼠体内具有口服生物利用度, 生物利用度为 74.91%, 半衰期为 4.32 小时。此外, GIBH-130 具有良好的血脑屏障穿透能力 (AUCBrain/Plasma=0.21)[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (138.73 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) H2O 中的溶解度 : <0.1 mg/mL (insoluble)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.7746 mL	13.8731 mL	27.7462 mL
		5 mM	0.5549 mL	2.7746 mL	5.5492 mL
		10 mM	0.2775 mL	1.3873 mL	2.7746 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 (6.94 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 ddH₂ O 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 (6.94 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 (6.94 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]. Zhou W, et al. Microglia-Based Phenotypic Screening Identifies a Novel Inhibitor of Neuroinflammation Effective in Alzheimer's Disease Models. ACS Chem Neurosci. 2016 Nov 16;7(11):1499-1507.

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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.7746 mL	13.8731 mL	27.7462 mL	69.3654 mL
	5 mM	0.5549 mL	2.7746 mL	5.5492 mL	13.8731 mL
	10 mM	0.2775 mL	1.3873 mL	2.7746 mL	6.9365 mL
	15 mM	0.1850 mL	0.9249 mL	1.8497 mL	4.6244 mL
	20 mM	0.1387 mL	0.6937 mL	1.3873 mL	3.4683 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: shyyssw@sina.com

	25 mM	0.1110 mL	0.5549 mL	1.1098 mL	2.7746 mL
	30 mM	0.0925 mL	0.4624 mL	0.9249 mL	2.3122 mL
	40 mM	0.0694 mL	0.3468 mL	0.6937 mL	1.7341 mL
	50 mM	0.0555 mL	0.2775 mL	0.5549 mL	1.3873 mL
	60 mM	0.0462 mL	0.2312 mL	0.4624 mL	1.1561 mL
	80 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3468 mL	0.8671 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1387 mL	0.2775 mL	0.6937 mL



源叶