



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: **AZD7325**
CAS 号: **942437-37-8**
产品货号: **S87751**

生物活性:

Description	AZD7325 是具有口服活性的 α 2,3 receptor 的正向别构调节剂 (PAM), K_i 分别是 0.3 and 1.3 nM, 但在 α 1 和 α 5 受体亚型上效果较差。AZD7325 是一种中等 CYP1A2 和强效 CYP3A4 诱导剂。AZD7325 具有用于焦虑和 dravet 综合征相关研究的潜力。				
IC50 & Target[2]	CYP1A2	CYP3A4			
In Vitro	AZD7325 是一种高亲和力和选择性的 GABAA 受体系统调节剂, 在 GABAA α 1、 α 2 和 α 3 上表现出高结合亲和力 (K_i =0.5、0.3 和 1.3 nM, GABAA α 5 (K_i =230 nM)[4]。				
	AZD7325 (0-10 μ M; 连续 3 天; 每天一次) 导致来自供体 HH210、HH215 和 HH216 的人肝细胞中 CYP1A2 mRNA 的最大表达分别为 3.2 倍、2.1 倍和 2.5 倍[2]。				
	AZD7325 (0-10 μ M; 连续 3 天; 每天一次) 在供体 HH210 的人肝细胞中引起 CYP1A2 和 CYP3A4 蛋白表达[2]。				
	RT-PCR[2]				
	Cell Line:	Primary human hepatocytes from one female (HH210) and two male (HH215, HH216) donors			
	Concentration:	0.01, 0.1, 1, 10 μ M			
	Incubation Time:	3 consecutive days			
	Result:	Led to increase of CYP1A2 mRNA expression			
	Western Blot Analysis[2]				
	Cell Line:	Primary human hepatocytes from donors			
	Concentration:	0.01, 0.1, 1, 10 μ M			
	Incubation Time:	3 consecutive days			
	Result:	Increased CYP1A2 and CYP3A4 protein level.			
In Vivo	AZD7325 (口服给药; 10、17.8 或 31.6 mg/kg; 诱导热疗前 30 分钟) 可减轻热疗引起的癫痫发作, 不同处理组的中值阈值分别为 42.8° C (10 mg/kg), 43.3° C (17.8 mg/kg), 43.4° C (31.6 mg/kg); 而载体组中为 42.2° C[3]。				
	Animal Model:	Male and female P18 - P20 F1.Scn1a+/- mice[3]			
	Dosage:	10, 17.8 or 31.6 mg/kg			
	Administration:	Oral administration; 30 minutes before the induction of hyperthermia			
	Result:	Attenuated hyperthermia-induced seizures in F1.Scn1a+/- mice with no sedative effect.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (282.18 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.8218 mL	14.1091 mL	28.2183 mL
		5 mM	0.5644 mL	2.8218 mL	5.6437 mL
		10 mM	0.2822 mL	1.4109 mL	2.8218 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。					



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

	储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.87 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.87 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Chen X, et al. The central nervous system effects of the partial GABA-A α 2,3 -selective receptor modulator AZD7325 in comparison with lorazepam in healthy males.Br J Clin Pharmacol. 2014 Dec;78(6):1298-314. [2]. Zhou D, et al. A clinical study to assess CYP1A2 and CYP3A4 induction by AZD7325, a selective GABA(A) receptor modulator - an in vitro and in vivo comparison.Br J Clin Pharmacol. 2012 Jul;74(1):98-108. [3]. Nomura T, et al. Potentiating α 2 subunit containing perisomatic GABAA receptors protects against seizures in a mouse model of Dravet syndrome.J Physiol. 2019 Aug;597(16):4293-4307. [4]. AZD7325,Mechanism of action: Gamma-aminobutyric acid receptor A alpha 2 & 3 (GABAA α 2,3) positive modulator.

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



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

DMSO	1 mM	2.8218 mL	14.1091 mL	28.2183 mL	70.5457 mL
	5 mM	0.5644 mL	2.8218 mL	5.6437 mL	14.1091 mL
	10 mM	0.2822 mL	1.4109 mL	2.8218 mL	7.0546 mL
	15 mM	0.1881 mL	0.9406 mL	1.8812 mL	4.7030 mL
	20 mM	0.1411 mL	0.7055 mL	1.4109 mL	3.5273 mL
	25 mM	0.1129 mL	0.5644 mL	1.1287 mL	2.8218 mL
	30 mM	0.0941 mL	0.4703 mL	0.9406 mL	2.3515 mL
	40 mM	0.0705 mL	0.3527 mL	0.7055 mL	1.7636 mL
	50 mM	0.0564 mL	0.2822 mL	0.5644 mL	1.4109 mL
	60 mM	0.0470 mL	0.2352 mL	0.4703 mL	1.1758 mL
	80 mM	0.0353 mL	0.1764 mL	0.3527 mL	0.8818 mL
	100 mM	0.0282 mL	0.1411 mL	0.2822 mL	0.7055 mL

源叶