



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: **SR 8278**
CAS 号: **1254944-66-5**
产品货号: **S87967**

生物活性:

Description	SR8278 是一种 REV-ERB α 拮抗剂,可抑制 REV-ERB α 的转录,其 EC50 值为 0.47 μM。SR8278 用于调节生物体内代谢,研究生物节律。SR8278 还可用于杜氏肌营养不良和阿尔茨海默病的研究。				
IC50 & Target	EC50: 0.47 μM (REV-ERB α) [1]				
In Vitro	SR8278 具有抑制 REV-ERB α 转录抑制活性,其 EC50 为 0.47 μM [1]。				
In Vivo	SR8278 (微量缓慢注射, 20 μg/只小鼠) 可在 6-OHDA 损伤小鼠中以昼夜节律依赖性的方式发挥抗抑郁和抗焦虑作用,并恢复与情绪相关行为的昼夜节律[1]。				
	SR8278 (微量缓慢注射, 20 μg/只小鼠) 可恢复 REV-ERB α 和 NURR1 对酪氨酸羟化酶启动子的结合活性,并促进 REV-ERB α 和 NURR1 识别的 R/N 模体的富集[1]。				
	Animal Model:	6-OHDA-lesioned mice [1]			
	Dosage:	20 μg/mouse			
	Administration:	slow microinjection; 20 μg/mouse			
In Vivo	Result:	Recovered mood-related behavioral deficits shown in 6-OHDA-lesioned mice.			
		Altered remaining DAergic neuron specific transcription levels of REV-ERBα and Nurr1 in the VTA.			
		Restored antagonistic crosstalk of REV-ERBα and NURR1 binding activity to TH promoter and TH protein levels in VTA.			
		Induced enrichments of REV-ERBα and NURR1 binding motifs at dawn.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (276.64 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	2.7664 mL	13.8320 mL	27.6640 mL
		5 mM	0.5533 mL	2.7664 mL	5.5328 mL
10 mM		0.2766 mL	1.3832 mL	2.7664 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, 1 year; -20°C, 6 months。 -80°C 储存时,请在 1 年内使用, -20°C 储存时,请在 6 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 (6.92 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 (6.92 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 (6.92 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]. Kojetin , et al. Identification of SR8278, a synthetic antagonist of the nuclear heme receptor REV-ERB. ACS Chem Biol. 2011 Feb 18;6(2):131-4. [2]. Dong D, et al. A validated ultra-performance liquid chromatography-tandem mass spectrometry method to identify the pharmacokinetics of SR8278 in normal and streptozotocin-induced diabetic rats. J Chromatogr B Analyt Technol Biomed Life Sci. 2016 May 1;1020:142-7. [3]. Jeongah Kim, et al. Pharmacological Rescue with SR8278, a Circadian Nuclear Receptor REV-ERB α Antagonist as a Therapy for Mood Disorders in Parkinson's Disease. Neurotherapeutics. 2022 Mar;19(2):592-607.

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, 1 year; -20° C, 6 months. -80° C 储存时, 请在 1 年内使用, -20° C 储存时, 请在 6 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	1 mM	2.7664 mL	13.8320 mL	27.6640 mL	69.1601 mL
	5 mM	0.5533 mL	2.7664 mL	5.5328 mL	13.8320 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

	10 mM	0.2766 mL	1.3832 mL	2.7664 mL	6.9160 mL
	15 mM	0.1844 mL	0.9221 mL	1.8443 mL	4.6107 mL
	20 mM	0.1383 mL	0.6916 mL	1.3832 mL	3.4580 mL
	25 mM	0.1107 mL	0.5533 mL	1.1066 mL	2.7664 mL
	30 mM	0.0922 mL	0.4611 mL	0.9221 mL	2.3053 mL
	40 mM	0.0692 mL	0.3458 mL	0.6916 mL	1.7290 mL
	50 mM	0.0553 mL	0.2766 mL	0.5533 mL	1.3832 mL
	60 mM	0.0461 mL	0.2305 mL	0.4611 mL	1.1527 mL
	80 mM	0.0346 mL	0.1729 mL	0.3458 mL	0.8645 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1383 mL	0.2766 mL	0.6916 mL



源叶