



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: **CP 376395**
CAS 号: **175140-00-8**
产品货号: **S88056**

生物活性:

Description	CP 376395 是一种有效的选择性的,可透过大脑的促肾上腺皮质激素释放因子 1 (CRF1) 受体拮抗剂。				
IC50 & Target	CRFR1		CRFR2		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	IMR-32	IC50	5.1 nM	Displacement of [125I]-sauvagine from rat CRF-1 receptor expressed in human IMR-32 cells after 2 hrs by scintillation counting	
In Vitro	CP 376395 完全拮抗大鼠大脑皮层和人 CRF1 受体中 oCRF 刺激的腺苷酸环化酶活性,表现 Ki 值为 12 nM,表明具有拮抗剂功能活性。 对人类 CRF1 受体亚型具有高度选择性; 对 CRF2 受体的亲和力 >10000 nM。 它对 40 种神经递质受体和离子通道的亲和力大于 1 μM[1].				
In Vivo	CP 376395 (10-20 mg/kg, 腹腔注射, 雄性 B6 小鼠) 会减少 H2O 和食物摄入量, 增加蔗糖摄入量, 减少 EtOH 摄入量, 但不会减少 EtOH 偏好[2]。				
	Animal Model:		Male B6 mice (n=8-9 per group)[2]		
	Dosage:		0.0, 10.0, or 20.0 mg/kg		
	Administration:		Intraperitoneally		
	Result:		Dose-dependently attenuated intake of H2O and food, with H2O intake affected specifically during the first half of the session.		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (306.30 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) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.0630 mL	15.3149 mL	30.6297 mL
		5 mM	0.6126 mL	3.0630 mL	6.1259 mL
		10 mM	0.3063 mL	1.5315 mL	3.0630 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				



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

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.66 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (7.66 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.66 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]. Chen YL, et al. 2-aryloxy-4-alkylaminopyridines: discovery of novel corticotropin-releasing factor 1 antagonists. J Med Chem. 2008 Mar 13;51(5):1385-92. [2]. Giardino WJ, et al. CRF1 receptor signaling regulates food and fluid intake in the drinking-in-the-dark model of binge alcohol consumption. Alcohol Clin Exp Res. 2013 Jul;37(7):1161-70.

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year. -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.0630 mL	15.3149 mL	30.6297 mL	76.5744 mL
	5 mM	0.6126 mL	3.0630 mL	6.1259 mL	15.3149 mL
	10 mM	0.3063 mL	1.5315 mL	3.0630 mL	7.6574 mL
	15 mM	0.2042 mL	1.0210 mL	2.0420 mL	5.1050 mL
	20 mM	0.1531 mL	0.7657 mL	1.5315 mL	3.8287 mL
	25 mM	0.1225 mL	0.6126 mL	1.2252 mL	3.0630 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

	30 mM	0.1021 mL	0.5105 mL	1.0210 mL	2.5525 mL
	40 mM	0.0766 mL	0.3829 mL	0.7657 mL	1.9144 mL
	50 mM	0.0613 mL	0.3063 mL	0.6126 mL	1.5315 mL
	60 mM	0.0510 mL	0.2552 mL	0.5105 mL	1.2762 mL
	80 mM	0.0383 mL	0.1914 mL	0.3829 mL	0.9572 mL
	100 mM	0.0306 mL	0.1531 mL	0.3063 mL	0.7657 mL



源叶