



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: shyyysw@sina.com

产品名称: LIT-001
CAS 号: 2245072-21-1
产品货号: S89019

生物活性:

Description	LIT-001 是第一种非肽类催产素受体 (OT-R) 激动剂 (EC50=55 nM; Ki=226 nM)。LIT-001 改善孤独症小鼠模型的社交互动。				
IC50 & Target	EC50: 55 nM (OT-R)[1] Ki: 226 nM (OT-R)[1]				
In Vitro	在体外信号实验中, LIT-001 是该受体两条主要信号通路的无偏向 OT-R 激动剂, 仅在高浓度下观察到对 V1a 受体的拮抗作用, 对 V1b 受体的激动作用较小[1]。				
In Vivo	LIT-001 (10-20 mg/kg; 腹腔注射) 缓解自闭症谱系障碍 (ASD) 的核心症状[1]。				
	Animal Model:	Oprm1-/- mice (bred in house on a 50% 129SVPas-50% C57BL/6J hybrid background)[1]			
	Dosage:	10, 20 mg/kg			
	Administration:	i.p.			
	Result:	Alleviated core symptoms in the context of ASD.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (154.87 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	1.5487 mL	7.7435 mL	15.4871 mL
		5 mM	0.3097 mL	1.5487 mL	3.0974 mL
		10 mM	0.1549 mL	0.7744 mL	1.5487 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 (sealed storage, away from moisture)。-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: ≥ 2.17 mg/mL (3.36 mM); 澄清溶液					
此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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					



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: shyyysw@sina.com

	溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (3.36 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (3.36 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 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 21.7 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]. Frantz MC, et al. LIT-001, the First Nonpeptide Oxytocin Receptor Agonist that Improves Social Interaction in a Mouse Model of Autism. J Med Chem. 2018 Oct 11;61(19):8670-8692.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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	1 mM	1.5487 mL	7.7435 mL	15.4871 mL	38.7177 mL
	5 mM	0.3097 mL	1.5487 mL	3.0974 mL	7.7435 mL
	10 mM	0.1549 mL	0.7744 mL	1.5487 mL	3.8718 mL
	15 mM	0.1032 mL	0.5162 mL	1.0325 mL	2.5812 mL
	20 mM	0.0774 mL	0.3872 mL	0.7744 mL	1.9359 mL
	25 mM	0.0619 mL	0.3097 mL	0.6195 mL	1.5487 mL
	30 mM	0.0516 mL	0.2581 mL	0.5162 mL	1.2906 mL
	40 mM	0.0387 mL	0.1936 mL	0.3872 mL	0.9679 mL
	50 mM	0.0310 mL	0.1549 mL	0.3097 mL	0.7744 mL
	60 mM	0.0258 mL	0.1291 mL	0.2581 mL	0.6453 mL
	80 mM	0.0194 mL	0.0968 mL	0.1936 mL	0.4840 mL
	100 mM	0.0155 mL	0.0774 mL	0.1549 mL	0.3872 mL