



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: **AZD-8529 mesylate**

CAS 号: **1314217-69-0**

产品货号: **S89053**

生物活性:

生物活性:

Description	AZD-8529 mesylate 是一种有效的, 高度选择性的, 可口服的 mGluR2 正向调节剂, EC50 值为 285 nM; 在 20-25 M 的浓度范围内, 对 mGluR1, 3, 4, 5, 6, 7 和 8 没有正向调节作用。				
IC50 & Target[1]	mGluR2 285 nM (EC50)				
In Vitro	AZD-8529 mesylate 增强谷氨酸对 mGluR2 的作用, 其 EC50 为 195 nM[1]。 在 25 μM 浓度下, AZD-8529 mesylate 不会在 mGluR 受体上引发拮抗反应[1]。				
In Vivo	AZD-8529 mesylate (0.3-mg/kg, 肌肉注射) 减少松鼠猴中尼古丁诱导的复发行为和由提示诱导的复发行为[1]。 AZD-8529 mesylate (30 mg/kg; 腹腔注射) 可降低自由活动大鼠伏隔核壳区由尼古丁诱导的细胞外多巴胺水平升高[1].				
	Animal Model:	Sprague-Dawley rats[1]			
	Dosage:	10 mg/kg, 30 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; 2 hours before nicotine injections			
	Result:	Decreased the increased extracellular dopamine induced by nicotine (0.4 mg/kg, s.c.) in accumbens shell of freely-moving rats.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 41.67 mg/mL (71.40 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	1.7136 mL	8.5678 mL	17.1356 mL
		5 mM	0.3427 mL	1.7136 mL	3.4271 mL
		10 mM	0.1714 mL	0.8568 mL	1.7136 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.56 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (3.56 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (3.56 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Justinova Z, et al. The Novel Metabotropic Glutamate Receptor 2 Positive Allosteric Modulator, AZD8529, Decreases Nicotine Self-Administration and Relapse in Squirrel Monkeys. Biol Psychiatry. 2015 Oct 1;78(7):452-62.

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	1.7136 mL	8.5678 mL	17.1356 mL	42.8390 mL
	5 mM	0.3427 mL	1.7136 mL	3.4271 mL	8.5678 mL
	10 mM	0.1714 mL	0.8568 mL	1.7136 mL	4.2839 mL
	15 mM	0.1142 mL	0.5712 mL	1.1424 mL	2.8559 mL
	20 mM	0.0857 mL	0.4284 mL	0.8568 mL	2.1420 mL
	25 mM	0.0685 mL	0.3427 mL	0.6854 mL	1.7136 mL
	30 mM	0.0571 mL	0.2856 mL	0.5712 mL	1.4280 mL
	40 mM	0.0428 mL	0.2142 mL	0.4284 mL	1.0710 mL
	50 mM	0.0343 mL	0.1714 mL	0.3427 mL	0.8568 mL
	60 mM	0.0286 mL	0.1428 mL	0.2856 mL	0.7140 m