



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

产品名称: **FG 7142**
CAS 号: **78538-74-6**
产品货号: **S89056**

生物活性:

Description	FG 7142 (ZK 39106; LSU-65) 是一种非选择性的苯二氮杂卓反向激动剂, 对含 $\alpha 1$ 亚基的 GABAA receptor 具有高亲和力 ($K_i=91$ nM)。FG 7142 (ZK 39106; LSU-65) 还调节表达 $\alpha 1$ 亚基的 GABAA 受体上 GABA 诱导的氯通量 ($EC_{50}=137$ nM)。FG 7142 (ZK 39106; LSU-65) 可以增加酪氨酸羟化并导致小鼠大脑皮层中 β -肾上腺素受体的上调。			
IC50 & Target	K_i : 91 nM (GABAA receptor)[1]			
In Vitro	FG-7142 对 α 亚基表达有亲和力, 对 $\alpha 1$ 、 $\alpha 2$ 、 $\alpha 3$ 和 $\alpha 5$ 亚基的 K_i 值分别为 91 nM; 330 nM; 492 nM 和 2.150 μ M[1]。 FG-7142 对表达 $\alpha 1$ 亚基 ($EC_{50}=137$ nM) 的 GABAA 受体上 GABA 诱导的氯化物通量的调节效果相比于其他 α 亚基 (EC_{50} : $\alpha 2=507$ nM, $\alpha 3=1.021$ μ M, $\alpha 5=1.439$ μ M) 很高效[1]。			
In Vivo	FG-7142 (腹膜内注射; 15-30 mg/kg) 激活中脑边缘皮质多巴胺能投射, 导致大鼠前额皮质和伏隔核中的多巴胺增加[1]。 FG -7142 (腹膜内注射; 15 mg/kg) 在体内增加内侧前额叶皮层和腹侧被盖的酪氨酸羟化酶活性和多巴胺转换, 但在中脑边缘或黑质纹状体区域未检测到影响[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (443.95 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
		1 mM	4.4395 mL	22.1976 mL
		5 mM	0.8879 mL	4.4395 mL
		10 mM	0.4440 mL	2.2198 mL
	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 (11.10 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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 ddH ₂ O 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 (11.10 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 (11.10 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]. Cottone P, et al. FG 7142 specifically reduces meal size and the rate and regularity of sustained feeding in female rats: evidence that benzodiazepine inverse agonists reduce food palatability. <i>Neuropsychopharmacology</i>. 2007 May;32(5):1069-81. Epub 2006 Nov 1.

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, 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.4395 mL	22.1976 mL	44.3951 mL	110.9878 mL
	5 mM	0.8879 mL	4.4395 mL	8.8790 mL	22.1976 mL
	10 mM	0.4440 mL	2.2198 mL	4.4395 mL	11.0988 mL
	15 mM	0.2960 mL	1.4798 mL	2.9597 mL	7.3992 mL
	20 mM	0.2220 mL	1.1099 mL	2.2198 mL	5.5494 mL
	25 mM	0.1776 mL	0.8879 mL	1.7758 mL	4.4395 mL
	30 mM	0.1480 mL	0.7399 mL	1.4798 mL	3.6996 mL
	40 mM	0.1110 mL	0.5549 mL	1.1099 mL	2.7747 mL
	50 mM	0.0888 mL	0.4440 mL	0.8879 mL	2.2198 mL
	60 mM	0.0740 mL	0.3700 mL	0.7399 mL	1.8498 mL
	80 mM	0.0555 mL	0.2775 mL	0.5549 mL	1.3873 mL
	100 mM	0.0444 mL	0.2220 mL	0.4440 mL	1.1099 mL