



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: **SSD114 hydrochloride**

CAS 号: **2319790-02-6**

产品货号: **S89157**

生物活性:				
Description	SSD114 hydrochloride 是一种新型 GABAB 受体正变构调节剂。			
IC50 & Target	GABAB receptor[1]			
In Vitro	In the presence of 10 μ M GABA, SSD114 hydrochloride at 25 μ M significantly increases (to approximately 170% above basal levels) the [35S]GTP γ S stimulation induced by GABA alone. SSD114 hydrochloride, added at 15 and 30 μ M, induces a leftward shift of the GABA concentration-response curve with a slight concomitant increase of maximal GABA stimulation at the highest concentration. In the presence of both 15 and 30 μ M SSD114 hydrochloride, the EC50 for GABA decreases by 2 and 2.5 fold, respectively, while the maximal stimulation (Emax) is potentiated only at the concentration of 30 μ M, reaching $161 \pm 5.09\%$ over the basal value[1].			
In Vivo	The onset of loss of righting reflex (LORR) is reduced by pretreatment with SSD114 hydrochloride [F(5,30)=4.55, P<0.005]. Post hoc analysis indicates that the onset of LORR is significantly lower in mouse groups pretreated with doses of SSD114 hydrochloride equal to or higher than 10 mg/kg than in vehicle-treated mice. The duration of LORR is increased by pretreatment with SSD114 hydrochloride [F(5,30)=4.81, P<0.005]. Post hoc analysis indicates that the duration of LORR is significantly longer in mouse groups pretreated with 10 and 100 mg/kg SSD114 hydrochloride than in vehicle-treated mice[1].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 130 mg/mL (335.20 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) H2O 中的溶解度 : 2 mg/mL (5.16 mM; 超声助溶 (<60°C))			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.5784 mL	12.8922 mL
		5 mM	0.5157 mL	2.5784 mL
		10 mM	0.2578 mL	1.2892 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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 3.25 mg/mL (8.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。			



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 32.5 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: 3.25 mg/mL (8.38 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 3.25 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 32.5 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: $\geq$ 3.25 mg/mL (8.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 3.25 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 32.5 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]. Porcu A, et al. In vitro and in vivo pharmacological characterization of SSD114, a novel GABAB positive allosteric modulator. Eur J Pharmacol. 2016 Nov 15;791:115-123.

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, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.5784 mL	12.8922 mL	25.7845 mL	64.4612 mL
	5 mM	0.5157 mL	2.5784 mL	5.1569 mL	12.8922 mL
DMSO	10 mM	0.2578 mL	1.2892 mL	2.5784 mL	6.4461 mL
	15 mM	0.1719 mL	0.8595 mL	1.7190 mL	4.2974 mL
	20 mM	0.1289 mL	0.6446 mL	1.2892 mL	3.2231 mL
	25 mM	0.1031 mL	0.5157 mL	1.0314 mL	2.5784 mL
	30 mM	0.0859 mL	0.4297 mL	0.8595 mL	2.1487 mL
	40 mM	0.0645 mL	0.3223 mL	0.6446 mL	1.6115 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

	50 mM	0.0516 mL	0.2578 mL	0.5157 mL	1.2892 mL
	60 mM	0.0430 mL	0.2149 mL	0.4297 mL	1.0744 mL
	80 mM	0.0322 mL	0.1612 mL	0.3223 mL	0.8058 mL
	100 mM	0.0258 mL	0.1289 mL	0.2578 mL	0.6446 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶