



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: **PW0787**
CAS 号: **2624131-45-7**
产品货号: **S89317**

生物活性:

Description	PW0787 是一种有效的, 选择性的, 具有口服活性的, 可透过血脑屏障的 GPR52 激动剂 (EC50=135 nM)。PW0787 抑制精神刺激行为。				
IC50 & Target	EC50: 135 nM (GPR52)[1].				
In Vivo	PW0787 (0.3、1、3 或 10 mg/kg; IP) 通过显著抑制苯丙胺诱导的小鼠过度运动行为显示抗精神病药样活性[1]。 大鼠经口服 (PO) 单次给药 20 mg/kg 或静脉内 (IV) 给药 10 mg/kg。PW0787 在 PO (AUC0-inf=13, 749 ng h/mL) 和 IV 给药 (AUC0-inf=9030 ng h/mL) 后具有出色的血浆暴露, 并且在 PO (Cmax=3407 ng/mL) 和 IV 给药 (Cmax=6726 ng/mL) 后具有较高的最大血清浓度。此外, PW0787 静脉注射 10 mg/kg 后, 血浆分布容积良好 (Vss=1.5 L/kg), 血浆清除率可接受 (CL=1.1 L/h/kg)。口服生物利用度 (F) 极佳, 为 76%[1]。				
	Animal Model:	Naïve male C57/BL6 mice weighing between 24 and 31 g			
	Dosage:	0.3, 1, 3, or 10 mg/kg (dissolved in 0.9% saline containing 20% HP-β-CD with a final pH of the solution adjusted to 7.4)			
	Administration:	IP			
	Result:	Suppressed amphetamine (AMPH)-induced horizontal activity at both 3 mg/kg and 10 mg/kg doses.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (108.60 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	2.1719 mL	10.8596 mL	21.7193 mL
		5 mM	0.4344 mL	2.1719 mL	4.3439 mL
		10 mM	0.2172 mL	1.0860 mL	2.1719 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 (protect from light)。-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: ≥ 2.5 mg/mL (5.43 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。					



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

	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% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Wang P, et al. Discovery of Potent and Brain-Penetrant GPR52 Agonist that Suppresses Psychostimulant Behavior. J Med Chem. 2020;63(22):13951-13972.

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 (protect from light)。-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	2.1719 mL	10.8596 mL	21.7193 mL	54.2982 mL
	5 mM	0.4344 mL	2.1719 mL	4.3439 mL	10.8596 mL
	10 mM	0.2172 mL	1.0860 mL	2.1719 mL	5.4298 mL
	15 mM	0.1448 mL	0.7240 mL	1.4480 mL	3.6199 mL
	20 mM	0.1086 mL	0.5430 mL	1.0860 mL	2.7149 mL
	25 mM	0.0869 mL	0.4344 mL	0.8688 mL	2.1719 mL
	30 mM	0.0724 mL	0.3620 mL	0.7240 mL	1.8099 mL
	40 mM	0.0543 mL	0.2715 mL	0.5430 mL	1.3575 mL
	50 mM	0.0434 mL	0.2172 mL	0.4344 mL	1.0860 mL
	60 mM	0.0362 mL	0.1810 mL	0.3620 mL	0.9050 mL
	80 mM	0.0271 mL	0.1357 mL	0.2715 mL	0.6787 mL
	100 mM	0.0217 mL	0.1086 mL	0.2172 mL	0.5430 mL