



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: **RTICBM-189**

CAS 号: **551909-15-0**

产品货号: **S89334**

生物活性:

Description	RTICBM-189 是一种有效的,可透过血脑屏障的大麻素 1 型 (CB1) 受体变构调节剂,在 Ca2+ 动员试验中 pIC50 为 7.54。RTICBM-189 对 hCB1 和 mCB1 的 pIC50 分别为 5.29 和 6.25。				
IC50 & Target[1]	CB1 7.54 (pIC50)	hCB1 5.29 (pIC50)	mCB1 6.25 (pIC50)		
In Vivo	RTICBM-189 (10 mg/kg; 腹腔注射)迅速吸收进入体循环,在给药后 0.4 小时的 tmax,plasma 观察到峰值血浆浓度 (Cmax,plasma=288.4 ng/mL)。大脑峰值水平也在 0.4 小时 (tmax,brain) 时达到, Cmax,brain 为 594.6 ng/mL[1]。				
	Animal Model:	Adult male Sprague-Dawley rats weighing 280-300 g[1]			
	Dosage:	10 mg/kg			
	Administration:	IP			
	Result:	Significantly attenuated drug-induced reinstatement of the cocaine-seeking behavior.			
	Animal Model:	Male Sprague-Dawley rats weighing 258-277 g[1]			
	Dosage:	10 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)			
	Administration:	IP			
	Result:	Plasma: Cmax (288.4 ng/mL), tmax (0.4 hours), CL_F (240.6 mL/min/kg), AUCinf (715.2 ng/mL × h), half-life t1/2 (9.9 hours). Brain: Cmax (594.6 ng/mL), tmax (0.4 hours), CL_F (120.7 mL/min/kg), AUCinf (1438.2 ng/mL × h).			
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (323.43 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	3.2343 mL	16.1713 mL	32.3426 mL
		5 mM	0.6469 mL	3.2343 mL	6.4685 mL
		10 mM	0.3234 mL	1.6171 mL	3.2343 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.09 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (6.73 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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。
参考文献	[1]. Nguyen T, et al. Development of 3-(4-Chlorophenyl)-1-(phenethyl)urea Analogues as Allosteric Modulators of the Cannabinoid Type-1 Receptor: RTICBM-189 is Brain Penetrant and Attenuates Reinstatement of Cocaine-Seeking Behavior [published online ahead of print, 2021 Dec 20]. J Med Chem. 2021;10.1021/acs.jmedchem.1c01432.

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	3.2343 mL	16.1713 mL	32.3426 mL	80.8564 mL
	5 mM	0.6469 mL	3.2343 mL	6.4685 mL	16.1713 mL
	10 mM	0.3234 mL	1.6171 mL	3.2343 mL	8.0856 mL
	15 mM	0.2156 mL	1.0781 mL	2.1562 mL	5.3904 mL
	20 mM	0.1617 mL	0.8086 mL	1.6171 mL	4.0428 mL
	25 mM	0.1294 mL	0.6469 mL	1.2937 mL	3.2343 mL
	30 mM	0.1078 mL	0.5390 mL	1.0781 mL	2.6952 mL
	40 mM	0.0809 mL	0.4043 mL	0.8086 mL	2.0214 mL
	50 mM	0.0647 mL	0.3234 mL	0.6469 mL	1.6171 mL
	60 mM	0.0539 mL	0.2695 mL	0.5390 mL	1.3476 mL
	80 mM	0.0404 mL	0.2021 mL	0.4043 mL	1.0107 mL
	100 mM	0.0323 mL	0.1617 mL	0.3234 mL	0.8086 mL