



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: **VU0453595**
CAS 号: **1432436-13-9**
产品货号: **S89696**

生物活性:

Description	VU0453595 is a highly selective, systemically active M1 positive allosteric modulator (PAM, EC50=2140 nM) for the research of schizophrenia[1][2].				
IC50 & Target	mAChR1				
In Vitro	使用 M1 PAM VU0453595 (3 μM) 可诱导中棘神经元 (MSN) 兴奋性暂时增加[3]。				
In Vivo	VU0453595 增强 M1 介导的毒蕈碱长期抑制 (mLTD)[1]。 VU0453595 (1-10 mg/kg; 腹腔内) 可逆转反复服用苯环利定 (PCP) 引起的行为缺陷[1]。 Animal Model: Male C57BL6/J mice (8-9 weeks old)[1] Dosage: 1, 3, or 10 mg/kg Administration: Intraperitoneal (i.p.); 10 mL/kg; administered 30 min before the social interaction test Result: Rescued deficits in social interaction observed in PCP-treated mice.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (310.23 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	3.1023 mL	15.5116 mL	31.0231 mL
		5 mM	0.6205 mL	3.1023 mL	6.2046 mL
		10 mM	0.3102 mL	1.5512 mL	3.1023 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。-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 (7.76 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 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 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)					



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

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.76 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。
参考文献	[1]. A Ghoshal, et al. Potentiation of M1 Muscarinic Receptor Reverses Plasticity Deficits and Negative and Cognitive Symptoms in a Schizophrenia Mouse Model. Neuropsychopharmacology. 2016 Jan;41(2):598-610. [2]. Sean P Moran, et al. M1-positive allosteric modulators lacking agonist activity provide the optimal profile for enhancing cognition. Neuropsychopharmacology. 2018 Jul;43(8):1763-1771. [3]. Xiaohui Lv, et al. M1 muscarinic activation induces long-lasting increase in intrinsic excitability of striatal projection neurons. Neuropharmacology. 2017 May 15;118:209-222.

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。 -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	3.1023 mL	15.5116 mL	31.0231 mL	77.5579 mL
	5 mM	0.6205 mL	3.1023 mL	6.2046 mL	15.5116 mL
	10 mM	0.3102 mL	1.5512 mL	3.1023 mL	7.7558 mL
	15 mM	0.2068 mL	1.0341 mL	2.0682 mL	5.1705 mL
	20 mM	0.1551 mL	0.7756 mL	1.5512 mL	3.8779 mL
	25 mM	0.1241 mL	0.6205 mL	1.2409 mL	3.1023 mL
	30 mM	0.1034 mL	0.5171 mL	1.0341 mL	2.5853 mL
	40 mM	0.0776 mL	0.3878 mL	0.7756 mL	1.9389 mL
	50 mM	0.0620 mL	0.3102 mL	0.6205 mL	1.5512 mL
	60 mM	0.0517 mL	0.2585 mL	0.5171 mL	1.2926 mL
	80 mM	0.0388 mL	0.1939 mL	0.3878 mL	0.9695 mL
	100 mM	0.0310 mL	0.1551 mL	0.3102 mL	0.7756 mL