



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: shyyw@sina.com

产品名称: THPP-1
CAS 号: 1257051-63-0
产品货号: S89998

生物活性:					
Description	THPP-1, a SGC chemical probe, is a potent and orally bioavailable phosphodiesterase 10A (PDE10A) inhibitor, with Ki values of 1 nM and 1.3 nM for human and rat PDE10A, respectively. THPP-1 has excellent pharmacokinetic properties in preclinical species[1].				
IC50 & Target	PDE10				
In Vivo	THPP-1（0.1-1.0 mg/kg，口服）在大鼠中显示出新物体识别能力[1]。				
	THPP-1（口服，1-30 mg/kg）剂量依赖性增加了大鼠纹状体中 GluR1 S845 的磷酸化，而纹状体中 GluR1 的总水平则没有受到影响。服用 THPP-1 还导致在本研究中所有剂量的 pGluR1/GluR1 比率均有所增加[1]。				
	THPP-1（1, 3, 10 mg/kg，口服）显著减弱了猴子在兴奋剂诱导的运动活动（SIMA）中的刺激效果[2]。				
	Animal Model:	Male Wistar Hannover rats ranging from 200 to 300 g[1].			
	Dosage:	0.1-1.0 mg/kg.			
	Administration:	P.O.			
	Result:	Showed novel object recognition.			
	Animal Model:	Eleven monkeys were surgically implanted with subcutaneous telemetric devices to permit the simultaneous recording of electrocorticogram (ECoG), electrooculogram (EOG), and electromyogram (EMG) activity			
	Dosage:	1, 3, 10 mg/kg.			
	Administration:	P.O.			
	Result:	Significantly attenuated the stimulant effects in SIMA.			
	Animal Model:	Male Wistar Hannover rats ranging from 200 to 300 g[1].			
	Dosage:	1-30 mg/kg.			
Administration:	P.O. (10% Tween 80/90% water) 2 h prior to tissue collection (Pharmacokinetic Analysis).				
Result:	Dose-dependently increases phosphorylation of GluR1 S845.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度：31.25 mg/mL (67.22 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	2.1510 mL	10.7550 mL	21.5100 mL
		5 mM	0.4302 mL	2.1510 mL	4.3020 mL
10 mM		0.2151 mL	1.0755 mL	2.1510 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用，-20℃ 储存时，请在 1 年内使用。					
参考文献	[1]. Smith SM, et al. The novel phosphodiesterase 10A inhibitor THPP-1 has antipsychotic-like effects in rat and improves cognition in rat and rhesus monkey. Neuropharmacology. 2013 Jan;64:215-23.				



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

[2]. Vardigan JD, et al. Behavioral and qEEG effects of the PDE10A inhibitor THPP-1 in a novel rhesus model of antipsychotic activity. Psychopharmacology (Berl). 2016 Jul;233(13):2441-50.

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	2.1510 mL	10.7550 mL	21.5100 mL	53.7750 mL
	5 mM	0.4302 mL	2.1510 mL	4.3020 mL	10.7550 mL
	10 mM	0.2151 mL	1.0755 mL	2.1510 mL	5.3775 mL
	15 mM	0.1434 mL	0.7170 mL	1.4340 mL	3.5850 mL
	20 mM	0.1076 mL	0.5378 mL	1.0755 mL	2.6888 mL
	25 mM	0.0860 mL	0.4302 mL	0.8604 mL	2.1510 mL
	30 mM	0.0717 mL	0.3585 mL	0.7170 mL	1.7925 mL
	40 mM	0.0538 mL	0.2689 mL	0.5378 mL	1.3444 mL
	50 mM	0.0430 mL	0.2151 mL	0.4302 mL	1.0755 mL
	60 mM	0.0359 mL	0.1793 mL	0.3585 mL	0.8963 mL