



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: **Spiramide**
CAS 号: **510-74-7**
产品货号: **T31535**

生物活性:						
Description	Spiramide (AMI-193) is a potent and selective antagonist of 5-HT2 and dopamine D2 receptor, with Kis of 2 nM and 3 nM, respectively. Spiramide has >2000-fold selectivity for 5-HT2 versus 5-HT1C (Ki=4300 nM) receptors. Spiramide exhibits antipsychotic activity[1][2][3].					
IC50 & Target	5-HT1C Receptor	5-HT2 Receptor	D2 Receptor	5-HT1A Receptor	D1 Receptor	5-HT1C Receptor
		2 nM (Ki)	3 nM (Ki)	50 nM (Ki)	2530 nM (Ki)	4300 nM (Ki)
In Vitro	Spiramide retains affinity for 5-HT1A sites (Ki=50 nM) and also binds at dopamine D2 sites (Ki=3 nM), but possesses low affinity for dopamine D1 sites (Ki=2530 nM)[1].					
In Vivo	AMI-193 (0.003-0.01 mg/kg; i.m.) dose-dependently decreases response rate in monkeys under a fixed-interval (FI) schedule of stimulus termination[2].					
	AMI-193 (0.003-0.01 mg/kg; i.m.) attenuates the discriminative-stimulus effects of cocaine in drug-discrimination experiments[2].					
	AMI-193 (0.003-0.01 mg/kg; i.m.) reduces response rate under a second-order schedule of i.v. self-administration of cocaine (0.1 mg/infusion)[2].					
	Animal Model:		Adult male squirrel monkeys (850-1300 g)[2]			
	Dosage:		0.003, 0.01 mg/kg			
	Administration:		I.m. on Tuesday, Wednesday, and Thursday the following week			
	Result:		Decreased the response rate. The rate-decreasing effects were reversed by cocaine.			
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 20 mg/mL (52.16 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 : < 0.1 mg/mL (insoluble)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	2.6078 mL	13.0392 mL	26.0783 mL	
		5 mM	0.5216 mL	2.6078 mL	5.2157 mL	
		10 mM	0.2608 mL	1.3039 mL	2.6078 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 (stored under nitrogen)。-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 mg/mL (5.22 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 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 ddH₂ 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) Solubility: 2 mg/mL (5.22 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2 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 20.0 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]. Ismaiel AM, et, al. Antagonism of 1-(2,5-dimethoxy-4-methylphenyl)-2-aminopropane stimulus with a newly identified 5-HT2- versus 5-HT1C-selective antagonist. J Med Chem. 1993 Aug 20;36(17):2519-25. [2]. Czoty PW, et, al. Behavioral effects of AMI-193, a 5-HT(2A)- and dopamine D(2)-receptor antagonist, in the squirrel monkey. Pharmacol Biochem Behav. 2000 Oct;67(2):257-64. [3]. Kjellberg B, et, al. Partial restoration by a neuroleptic (spiramide) of items of grooming behaviour suppressed by amphetamine. Arch Int Pharmacodyn Ther. 1974 Jul;210(1):61-6.

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℃, 6 months; -20℃, 1 month (stored under nitrogen)。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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	2.6078 mL	13.0392 mL	26.0783 mL	65.1958 mL
	5 mM	0.5216 mL	2.6078 mL	5.2157 mL	13.0392 mL
	10 mM	0.2608 mL	1.3039 mL	2.6078 mL	6.5196 mL
	15 mM	0.1739 mL	0.8693 mL	1.7386 mL	4.3464 mL
	20 mM	0.1304 mL	0.6520 mL	1.3039 mL	3.2598 mL
	25 mM	0.1043 mL	0.5216 mL	1.0431 mL	2.6078 mL
	30 mM	0.0869 mL	0.4346 mL	0.8693 mL	2.1732 mL
	40 mM	0.0652 mL	0.3260 mL	0.6520 mL	1.6299 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	0.0522 mL	0.2608 mL	0.5216 mL	1.3039 mL
--	-------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶