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：
2-{4-[4-Pyridin-4-yl-1-(2,2,2-trifluoro-ethyl)-1H-pyrazol-3-yl]-phenoxymethyl}-quinoline
产品别名：TP-10

生物活性：

Description

TP-10 is a PDE10A inhibitor with IC50 of 0.8 nM. IC50 value: 0.8 nM [1] Target: PDE10A TP-10 has extremely potent PDE10A inhibitory activity and high selectivity against other PDEs, and be active in the mouse behavioral model for positive symptoms. TP-10 demonstrats good in vitro and in vivo activity, the intrinsic clearance (CLint) of these compounds in mouse liver microsomes (MLM) was extremely high in assay (CLint>1000 mL/min/kg). [1]

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 100 mg/mL (217.18 mM)

H_2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	2.1718 mL	10.8589 mL	21.7179 mL
	5 mM	0.4344 mL	2.1718 mL	4.3436 mL
	10 mM	0.2172 mL	1.0859 mL	2.1718 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.97 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (5.97 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil

Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.97 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (5.97 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

References	[1]. Hamaguchi W, et al. Synthesis and in vivo evaluation of novel quinoline derivatives as phosphodiesterase 10A inhibitors. Chem Pharm Bull (Tokyo). 2014;62(12):1200-1213. [2]. Verhoest PR, et al. Discovery of a novel class of phosphodiesterase 10A inhibitors and identification of clinical candidate 2-[4-(1-methyl-4-pyridin-4-yl-1H-pyrazol-3-yl)-phenoxymethyl]-quinoline (PF-2545920) for the treatment of schizophrenia. J Med Chem

源叶生物