



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: **PF-3274167**

产品别名: **Cligosiban**

生物活性:				
Description	Cligosiban (PF-3274167), a high oral bioavailability and good brain-penetrant non-peptide oxytocin receptor antagonist, shows a high-affinity ($K_i=9.5$ nM) and an excellent selectivity versus the vasopressin receptors with almost no affinity for the V_{1b} and V_{1a} subtypes. Cligosiban inhibits ejaculatory physiology in rodents[1][2].			
IC ₅₀ & Target	K _i : 9.5 nM (oxytocin receptor)[2]			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 50 mg/mL (119.09 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.3819 mL	11.9093 mL
		5 mM	0.4764 mL	2.3819 mL
		10 mM	0.2382 mL	1.1909 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: ≥ 3 mg/mL (7.15 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL (7.15 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 30.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀, 向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 μ L 生理盐水定容至 1 mL。 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE- β -CD in saline) Solubility: ≥ 3 mg/mL (7.15 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL (7.15 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 30.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。 3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 3 mg/mL (7.15 mM); Clear solution			



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

	此方案可获得 $\geq 3 \text{ mg/mL}$ (7.15 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 30.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Wayman C, et al. Cligosiban, A Novel Brain-Penetrant, Selective Oxytocin Receptor Antagonist, Inhibits Ejaculatory Physiology in Rodents. J Sex Med. 2018 Dec;15(12):1698-1706. [2]. Karpenko IA, et al. Selective nonpeptidic fluorescent ligands for oxytocin receptor: design, synthesis, and application to time-resolved FRET binding assay. J Med Chem. 2015 Mar 12;58(5):2547-52.



源叶生物