

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	Y10005
产品名称:	YL0919

产品简介:

一种口服活性抗抑郁剂，具有双重活性，是一种高选择性的 5-HT uptake 阻滞剂和有效的 5-HT_{1A} receptor 激动剂 ($K_i=0.19$ nM)。Hypidone hydrochloride 对大鼠大脑皮层突触体和 HEK293 细胞摄取 [³H]-5-HT 有抑制作用，IC₅₀s 分别为 1.78 nM 和 1.93 nM。Hypidone hydrochloride 在动物模型中表现出明显的抗抑郁作用，对抑郁症的研究具有重要意义。

靶点: 5-HT_{1A} Receptor

体外研究:

Hypidone hydrochloride 抑制大鼠大脑皮层突触体和稳定表达 hSERT 的 HEK293 细胞摄取 [³H]-5-HT，IC₅₀ 值分别为 1.78 nM 和 1.93。

Hypidone hydrochloride (0.01 nM-10 μ M) 浓度依赖性抑制毛喉素刺激的 cAMP 形成，对 cAMP 形成具有浓度依赖性抑制作用，IC₅₀ 约 23.9 nM。在拮抗作用研究中，WAY-100635 可防止 Hypidone hydrochloride 介导的毛喉素刺激的 cAMP 形成抑制。

Hypidone hydrochloride 对大鼠 5-HT_{1A} 受体、SERT、NET、和 DATs，它以高亲和力 ($K_i=0.19$ 和 0.72 nM) 与 5-HT_{1A} 受体、血清素转运体 (SERT) 结合，但它与 NET 和 DAT 的亲和力较低，阻断 [³H]nisoxetine 和 [³H]win35428 结合 K_i 值分别为 650 nM 和 2652 nM。

体内研究:

Hypidone hydrochloride (YL0919) (口服给药; 1.25 或 5 mg/kg; 4 周) 和氟西汀 (10 mg/kg) 可逆转 CUS 大鼠的运动活动抑制。Hypidone hydrochloride (口服给药; 1.25、2.5 和 5 mg/kg; 4 周) 显著缩短小鼠 mPFC FST 中 TST 的不动时间。此外，Hypidone hydrochloride 对单独的 OFT 中的运动活动没有影响。此外，Hypidone hydrochloride 在 TST 和 FST 中的抗抑郁样作用因与 WAY-100635 共同给药而完全减弱。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 溶于 DMSO (≥ 30 mg/mL)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.9865 mL	14.9325 mL	29.8650 mL
5 mM	0.5973 mL	2.9865 mL	5.9730 mL
10 mM	0.2987 mL	1.4933 mL	2.9865 mL
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。			
二: 体内实验			



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

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.47 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.47 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.47 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，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存： -20℃

