

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	C50324
产品名称:	680C91

产品简介:

一种口服有效的,选择性色氨酸 2,3-双加氧酶 (TDO) 抑制剂, K_i 为 51nM。TDO 是色氨酸分解代谢的关键酶。680C91 可用于肿瘤免疫和阿尔茨海默症的研究。

体外研究:

680C91 是一种强效 ($K_i=51$ nM) 且选择性的 TDO 抑制剂, 在 $10 \mu\text{M}$ 浓度下对吡啶胺 2,3-双加氧酶、单胺氧化酶 A 和 B、5-HT 摄取以及 5-HT_{1A}、1D、2A 和 2C 受体没有抑制活性。

680C91 可抑制大鼠肝细胞和原位灌注大鼠肝脏对色氨酸的分解代谢。

Tdo2 可以调节细胞增殖并刺激子宫基质细胞和蜕膜细胞中蜕膜标志物 Dtp_{rp} 的表达。Tdo2 抑制剂 680C91 也能抑制 24 小时子宫蜕膜细胞的增殖活性。

用 680C91 (25 和 $50 \mu\text{M}$) 治疗平滑肌瘤平滑肌细胞 (LSMC) 和子宫肌层平滑肌细胞 (MSMC) 球体可显著抑制 I 型胶原蛋白 (COL1A1) 和 III 型胶原蛋白 (COL3A1) 的表达, 且这种抑制作用呈剂量依赖性。

体内研究:

680C91 (急性治疗剂量为 15 mg/kg) 可升高脑中色氨酸的含量。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO : 116.67 mg/mL (489.68 mM ; 超声助溶)

浓度	质量			
	溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM		4.1971 mL	20.9855 mL	41.9710 mL
5 mM		0.8394 mL	4.1971 mL	8.3942 mL
10 mM		0.4197 mL	2.0985 mL	4.1971 mL

储备液的保存方式: -80°C , 6 months; -20°C , 1 month.

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: 2.08 mg/mL (8.73 mM); 澄清溶液; 超声助溶

此方案可获得 2.08 mg/mL 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $400 \mu\text{L}$ PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 $50 \mu\text{L}$ Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 $450 \mu\text{L}$ 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: 2.08 mg/mL (8.73 mM); 澄清溶液; 超声助溶

此方案可获得 2.08 mg/mL 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \mu\text{L}$ 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。



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。

三、细胞实验

Cell Proliferation Assay

Cell Line:	Uterine stromal cells
Concentration:	0.01, 0.05, 0.1, 0.5, 1, 5, and 10 μ M
Incubation Time:	24hours
Result:	The proliferation activity of stromal cells was significantly decreased at 5 and 10 μ M.

Western Blot Analysis

Cell Line:	MSMC and LSMC
Concentration:	25 and 50 μ M
Incubation Time:	48 hours
Result:	Significantly reduced the expression of COL1A1 and COL3A1 in LSMC spheroids with no significant effect on expression of these proteins in MSMC spheroids.

四、动物实验

Animal Model:	Male C57B16/NCr1 mice aged 13-18 weeks
Dosage:	15 mg/kg
Administration:	Administered per os
Result:	Caused a significant increase in brain tryptophan.

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：2-8° C

