Beijing Jin Ming Biotechnology Co., Ltd.
Tel/Fax:010-60605840
邮箱：psaitong@jm-bio.com
网址：www.jm-bio.com

产品说明书

基本信息

产品编号：	P11381				
产品名称：	PDE2/PDE10-IN-1				
CAS：	1426833-08-0	储存条件	粉末	-20℃	四年
分子式：	C15H10ClN5		溶于液体	-80℃	六个月
分子量	295.73			-20℃	一个月
化学名：	PDE2/PDE10-IN-1	PDE2/PDE10-IN-1			
Solubility (25° C)：					
体外:	DMSO	12.5 mg/mL (42.27 mM; ultrasonic and warming and heat to 60° C)			
体内(现配现用):	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 → 5% Tween-80→45% saline Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (4.23 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (4.23 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 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% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (4.23 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (4.23 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 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。 3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% corn oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (4.23 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (4.23 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 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
＜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。					

制备储备液

浓度 \ 质量 / 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	3.3815 mL	16.9073 mL	33.8146 mL
5 mM	0.6763 mL	3.3815 mL	6.7629 mL
10 mM	0.3381 mL	1.6907 mL	3.3815 mL

生物活性

产品描述	PDE2/PDE10-IN-1 是一种磷酸二酯酶 PDE2 和 PDE10 抑制剂，IC50 分别为 29 和 480 nM。
体外研究	PDE2/PDE10-IN-1 (Compound 6) inhibits PDE2 and PDE10, respectively, with an IC50 value of 29 and 480 nM. PDE2/PDE10-IN-1 also inhibits PDE11A and PDE4D with IC50s of 6920 nM and 5890 nM, respectively. In addition PDE2/PDE10-IN-1 does not show significant inhibition of a panel of CYP450 enzymes (CYP1A2, 2C9, 2D6, 2C19, and 3A4). PDE2/PDE10-IN-1 is also inactive up to a concentration of 125 μg/mL in a bacterial mutagenicity assay

Beijing Jin Ming Biotechnology Co., Ltd.
Tel/Fax:010-60605840
邮箱：psaitong@jm-bio.com
网址：www.jm-bio.com

产品说明书

体内研究	The PK properties of PDE2/PDE10-IN-1 are studied in rats after 2.5 mg/kg i.v. and 10 mg/kg p.o. administration. After i.v. administration, a rapid clearance is observed (t1/2=0.47 h), which is not expected based on the in vitro metabolic stability in rat liver microsomes (rLMs). Interestingly, PDE2/PDE10-IN-1 shows much slower clearance after p.o. administration (t1/2=2.36 h), resulting in good bioavailability and a maximum plasma concentration (Cmax) of 997 ng/mL. PDE2/PDE10-IN-1 is assessed for its potential to cross the blood–brain barrier in rats after 10 mg/kg s.c. administration. PDE2/PDE10-IN-1 shows good formulatability with 10 to 20% HPβCD at pH>3.5. The brain concentration for PDE2/PDE10-IN-1 after 1 h administration is in the range of 370-895 ng/g with high brain free fractions and brain/plasma ratios. More specifically, PDE2/PDE10-IN-1, which is orally bioavailable, occupies PDE2 with an ED50 of 21 mg/kg