

产品名称: **VU 0357121**

产品别名: **VU 0357121**

生物活性:

Description

VU0357121 is a novel positive and highly selective allosteric modulator (PAM) of mGlu5R with EC₅₀ of 33 nM. IC₅₀ Value: 33 nM(EC₅₀) Target: mGluR5 in vitro: VU0357121 do not bind at the MPEP allosteric site of mGlu5, thus do not possess mGlu5 NAM activity. The A809V/rmGlu5 mutation inhibited the ability of VU0357121 to shift the glutamate concentration?response curve, whereas the response to VU0357121 is not altered by the F585I/rmGlu5 mutation. VU0357121 show weaker cooperativity in the Ca²⁺ mobilization assay in the low-expressing HEK293A-mGlu5 cell line. in vivo:

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 50 mg/mL (163.76 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing	1 mM		3.2753 mL	16.3763 mL	32.7525 mL
Stock Solutions	5 mM		0.6551 mL	3.2753 mL	6.5505 mL
	10 mM		0.3275 mL	1.6376 mL	3.2753 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: 2.5 mg/mL (8.19 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

此方案可获得 2.5 mg/mL (8.19 mM)的均匀悬浊液,悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (8.19 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.19 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中,混合均匀。

References

[1]. Hammond, Alexis S.; Rodriguez, Alice L.; Townsend, Steven D. et al. Discovery of a Novel Chemical Class of mGlu5 Allosteric Ligands with Distinct Modes of Pharmacology. ACS Chemical Neuroscience (2010), 1(10), 702-716.