



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

产品名称: **Varenicline**  
产品别名: **CP 526555**

生物活性:

Description	Varenicline (CP 526555) is a potent partial agonist for $\alpha 4\beta 2$ nicotinic acetylcholine receptor (nAChR) with a EC50 value of 2.3 $\mu$ M. Varenicline (CP 526555) is a full agonist for $\alpha 3\beta 4$ and $\alpha 7$ nAChRs with EC50 values of 55 $\mu$ M and 18 $\mu$ M, respectively[1]. Varenicline (CP 526555) is a nicotinic ligand based on the structure of cytosine, has the potential for smoking cessation treatment[2].					
IC <sub>50</sub> & Target	EC50: 2.3 $\mu$ M ( $\alpha 4\beta 2$ nAChR); 18 $\mu$ M ( $\alpha 7$ nAChR); 55 $\mu$ M ( $\alpha 3\beta 4$ nAChR)[1]					
In Vivo	Varenicline (CP 526555) (subcutaneous injection; 0.01, 0.05, 0.1 and 1 mg/kg; 3 days) iven 10 min prior to nicotine, inhibits nicotine CPP in a dose dependent manner. At the doses of 0.1 and 1 mg/kg totally blocks the effect of nicotine in CPP test without inducing significant changes in preferences on their own[2].					
	Varenicline (2.5 mg/kg) results in a place aversion that was dependent on $\alpha 5$ nAChRs but not $\beta 2$ nAChRs[2].					
	Varenicline (0.1 and 0.5 mg/kg) reverses nicotine withdrawal signs such as hyperalgesia and somatic signs and withdrawal-induced aversion in a dose-related manner[2].					
	Animal Model:	ICR male mice (8 weeks)[1]				
	Dosage:	0.01, 0.05, 0.1 and 1 mg/kg				
Administration:	3 days					
Result:	Supressed the effect of nicotine in CPP test.					
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b>					
	DMSO : 25 mg/mL (118.34 mM; Need ultrasonic)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	4.7335 mL	23.6675 mL	47.3350 mL	
		5 mM	0.9467 mL	4.7335 mL	9.4670 mL	
		10 mM	0.4734 mL	2.3668 mL	4.7335 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℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。					
	<b>In Vivo:</b>					
	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: $\geq$ 2.5 mg/mL (11.83 mM); Clear solution						
此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (11.83 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。						
以 1 mL 工作液为例，取 100 $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中，混合均匀。						



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

	<p>向上述体系中加入 50 <math>\mu</math>L Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 <math>\mu</math>L 生理盐水定容至 1 mL。</p> <p>2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO<math>\rightarrow</math> 90% (20% SBE-<math>\beta</math>-CD in saline)</p> <p>Solubility: <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (11.83 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (11.83 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 20% 的 SBE-<math>\beta</math>-CD 生理盐水水溶液中, 混合均匀。</p> <p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO <math>\rightarrow</math> 90% corn oil</p> <p>Solubility: <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (11.83 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (11.83 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中, 混合均匀。</p>
References	<p>[1]. Mihalak KB, et al. Varenicline is a partial agonist at alpha4beta2 and a full agonist at alpha7 neuronal nicotinic receptors.Mol Pharmacol. 2006 Sep;70(3):801-5. Epub 2006 Jun 9.</p> <p>[2]. Bagdas D, et al. New insights on the effects of varenicline on nicotine reward, withdrawal and hyperalgesia in mice.Neuropharmacology. 2018 Aug;138:72-79.</p>

源叶生物