



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
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **PNU-120596**
CAS 号: **501925-31-1**
产品货号: **S47640**

生物活性:

Description	PNU-120596 (NSC 216666) 是一种有效的选择性 $\alpha 7$ nAChR 阳性变构调节剂, EC50 为 216 nM。PNU-120596 对 $\alpha 4\beta 2$, $\alpha 3\beta 4$ 和 $\alpha 9\alpha 10$ nAChRs 无活性。PNU-120596 可用于精神病和神经疾病的研究。				
IC50 & Target	EC50: 216 nM ($\alpha 7$ nAChR)[1]				
In Vitro	PNU-120596 增加由人 $\alpha 7$ nAChR 工程变体介导的激动剂诱发的钙通量。电生理学研究证实, PNU-120596 会增加野生型受体介导的激动剂诱发电流峰值, 并且在激动剂持续存在的情况下, 诱发反应会显著延长。PNU-120596 增加了 $\alpha 7$ nAChR 的通道平均开放时间[1]。 当应用于急性海马切片时, PNU-120596 会增加在锥体神经元中测量到的 ACh 诱发的 GABA 突触后电流的频率[1]。 PNU-120596 通过引发与 ACh 促进的门控构象相似但不相同的构象效应, 增强激动剂诱发的烟碱受体门控[2]。				
In Vivo	PNU-120596 (1 mg/kg; 静脉注射; 一次) 治疗可改善安非他明引起的大鼠听觉门控缺陷, 该模型旨在反映与精神分裂症相关的回路水平紊乱[1]。 当在 carrageenan 之前给药时, NU-120596 (30 mg/kg; 腹腔注射) 可显著减轻 Sprague-Dawley 大鼠的机械痛觉过敏和负重缺陷长达 4 小时。PNU-120596 可减轻角叉菜胶诱导的后爪水肿内 TNF-α 和 IL-6 水平的增加[3]。				
	Animal Model:	Male Sprague Dawley rats (250-300 g) treated with Amphetamine[1]			
	Dosage:	1 mg/kg			
	Administration:	Intravenous injection; once			
	Result:	Improved the auditory gating deficit caused by Amphetamine.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (160.40 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.2080 mL	16.0400 mL	32.0801 mL
		5 mM	0.6416 mL	3.2080 mL	6.4160 mL
		10 mM	0.3208 mL	1.6040 mL	3.2080 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 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				



	请您现用现配，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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: 2.5 mg/mL (8.02 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.02 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。																														
参考文献	[1]. Hurst RS, et al. A novel positive allosteric modulator of the alpha7 neuronal nicotinic acetylcholine receptor: in vitro and in vivo characterization. J Neurosci, 2005, 25(17), 4396-4405. [2]. Barron SC, et al. An allosteric modulator of alpha7 nicotinic receptors, N-(5-Chloro-2,4-dimethoxyphenyl)-N'-(5-methyl-3-isoxazolyl)-urea (PNU-120596), causes conformational changes in the extracellular ligand binding domain similar to those caused by acetylcholine. Mol Pharmacol, 2009 76(2), 253-263. [3]. Munro G, et al. The α7 nicotinic ACh receptor agonist compound B and positive allosteric modulator PNU-120596 both alleviate inflammatory hyperalgesia and cytokine release in the rat. Br J Pharmacol, 2012, doi: 10.1111/j.1476-5381.2012.02003.x.																														
完整储备液配制表：																															
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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。																															
可选溶剂	<table><tr><td>质量 溶剂体积 浓度</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td><td>25 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>3.2080 mL</td><td>16.0400 mL</td><td>32.0801 mL</td><td>80.2002 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.6416 mL</td><td>3.2080 mL</td><td>6.4160 mL</td><td>16.0400 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.3208 mL</td><td>1.6040 mL</td><td>3.2080 mL</td><td>8.0200 mL</td></tr><tr><td>15 mM</td><td>0.2139 mL</td><td>1.0693 mL</td><td>2.1387 mL</td><td>5.3467 mL</td></tr><tr><td>20 mM</td><td>0.1604 mL</td><td>0.8020 mL</td><td>1.6040 mL</td><td>4.0100 mL</td></tr></table>	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	1 mM	3.2080 mL	16.0400 mL	32.0801 mL	80.2002 mL	5 mM	0.6416 mL	3.2080 mL	6.4160 mL	16.0400 mL	10 mM	0.3208 mL	1.6040 mL	3.2080 mL	8.0200 mL	15 mM	0.2139 mL	1.0693 mL	2.1387 mL	5.3467 mL	20 mM	0.1604 mL	0.8020 mL	1.6040 mL	4.0100 mL
质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg																											
1 mM	3.2080 mL	16.0400 mL	32.0801 mL	80.2002 mL																											
5 mM	0.6416 mL	3.2080 mL	6.4160 mL	16.0400 mL																											
10 mM	0.3208 mL	1.6040 mL	3.2080 mL	8.0200 mL																											
15 mM	0.2139 mL	1.0693 mL	2.1387 mL	5.3467 mL																											
20 mM	0.1604 mL	0.8020 mL	1.6040 mL	4.0100 mL																											
DMSO																															



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
邮箱: shyyssw@sina.com

	25 mM	0.1283 mL	0.6416 mL	1.2832 mL	3.2080 mL
	30 mM	0.1069 mL	0.5347 mL	1.0693 mL	2.6733 mL
	40 mM	0.0802 mL	0.4010 mL	0.8020 mL	2.0050 mL
	50 mM	0.0642 mL	0.3208 mL	0.6416 mL	1.6040 mL
	60 mM	0.0535 mL	0.2673 mL	0.5347 mL	1.3367 mL
	80 mM	0.0401 mL	0.2005 mL	0.4010 mL	1.0025 mL
	100 mM	0.0321 mL	0.1604 mL	0.3208 mL	0.8020 mL



源叶