



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: TGN020
CAS 号: 51987-99-6
产品货号: S87670

生物活性:				
Description	TGN-020 是一种选择性水通道蛋白 4 (AQP4) 抑制剂, IC ₅₀ 为 3.1 μM。TGN-020 是一种 PROTAC linker, 属于 alkyl chain 类, 可用于合成 PROTAC 分子。TGN-020 减轻大鼠脊髓压迫损伤后的水肿并抑制神经胶质瘢痕的形成。			
IC ₅₀ & Target	Alkyl-Chain			
In Vitro	PROTACs 包含由连接子连接的两种不同配体; 一种是针对 E3 泛素连接酶的配体, 另一种是针对目标蛋白的配体。PROTACs 利用细胞内的泛素-蛋白酶体系统来选择性地降解目标蛋白[3]。			
In Vivo	TGN-020 (剂量为 0.02 mg/μL; 通过玻璃体内注射两微升) 能够抑制由链脲佐菌素 (STZ) 诱导的糖尿病大鼠 (九周龄雄性 Wistar 大鼠) 视网膜中的水肿现象[2]。 TGN-020 (剂量为 100 mg/kg; 腹腔注射; 在脊髓损伤 (SCI) 后立即单次给药) 能在损伤后的第 3、7、14、21 和 28 天促进功能恢复, 并减少水肿程度, 同时在损伤后第三天抑制 AQP4、GFAP、PCNA 的表达。在患有脊髓损伤的成年雌性 Sprague-Dawley 大鼠 (体重 180-220 克, 年龄 9-10 周) 中, TGN-020 不仅抑制了胶质瘢痕的形成, 还上调了 GAP-43 的表达[4]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (80.83 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	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	4.8490 mL	24.2448 mL
		5 mM	0.9698 mL	4.8490 mL
		10 mM	0.4849 mL	2.4245 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.67 mg/mL (8.10 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.67 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 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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/			



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

	或超声的方式助溶。 方案 一 请依序添加每种溶剂: 0.5% Methyl cellulose/0.5% Tween-80 in Saline water Solubility: 5 mg/mL (24.24 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: 15% Cremophor EL → 85% Saline Solubility: 25 mg/mL (121.22 mM); 悬浊液; 超声助溶
参考文献	[1]. Vincent J Huber, et al. Identification of aquaporin 4 inhibitors using in vitro and in silico methods. Bioorg Med Chem. 2009 Jan 1;17(1):411-7. [2]. Shou Oosuka, et al. Effects of an Aquaporin 4 Inhibitor, TGN-020, on Murine Diabetic Retina. Int J Mol Sci. 2020 Mar 27;21(7):2324. [3]. An S, et al. Small-molecule PROTACs: An emerging and promising approach for the development of targeted therapy drugs. EBioMedicine. 2018 Oct;36:553-562 [4]. Jian Li, et al. TGN-020 alleviates edema and inhibits astrocyte activation and glial scar formation after spinal cord compression injury in rats. Life Sci. 2019 Apr 1;222:148-157.

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° 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.8490 mL	24.2448 mL	48.4896 mL	121.2239 mL
	5 mM	0.9698 mL	4.8490 mL	9.6979 mL	24.2448 mL
	10 mM	0.4849 mL	2.4245 mL	4.8490 mL	12.1224 mL
	15 mM	0.3233 mL	1.6163 mL	3.2326 mL	8.0816 mL
	20 mM	0.2424 mL	1.2122 mL	2.4245 mL	6.0612 mL
	25 mM	0.1940 mL	0.9698 mL	1.9396 mL	4.8490 mL
	30 mM	0.1616 mL	0.8082 mL	1.6163 mL	4.0408 mL
	40 mM	0.1212 mL	0.6061 mL	1.2122 mL	3.0306 mL
	50 mM	0.0970 mL	0.4849 mL	0.9698 mL	2.4245 mL
	60 mM	0.0808 mL	0.4041 mL	0.8082 mL	2.0204 mL
	80 mM	0.0606 mL	0.3031 mL	0.6061 mL	1.5153 mL