



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: shyyysw@sina.com

产品名称: NS 1738
CAS 号: 501684-93-1
产品货号: S87682

生物活性:

Description	NS 1738 (NSC 213859) 是一种新型的 α 7 nAChR 正向变构调节剂。在卵母细胞实验中, 正调节 α 7nAChR, EC50 为 3.4 μ M。				
IC50 & Target[1]	EC50: 3.4 μ M (α 7 nAChR, in oocyte experiments)[1].				
In Vitro	NS 1738 通过在所有浓度下增加乙酰胆碱 (ACh) 诱发电流的峰值振幅起作用; 因此, 它增加了 ACh 的最大功效。将峰值电流幅度与用于预孵育的 NS 1738 浓度的对数作图, 揭示了一种 S 形浓度-响应关系, 该关系非常符合希尔方程 (EC50=3.4 μ M)。在相似的实验条件下, NS 1738 对大鼠 α 7 nAChR 表现出相当的功效和效力 (EC50=3.9 μ M)[1]。				
In Vivo	为评估 NS 1738 渗透血脑屏障的能力, 大鼠腹膜内给药 10 mg/kg NS 1738。注射后约 30 分钟测量脑浓度峰值, 在此剂量下它们达到 ~80 ng/mL (~200 nM)。进入脑内的化合物量与血浆中的化合物量之比为 AUCbrain/AUCplasma=0.50。血浆中的半衰期估计为 42 分钟。在体外用分离的肝微粒体孵育 NS1738 表明, 在小鼠和大鼠中, 大约 60% 和 75% 的 NS 1738 在 1 小时内分别通过细胞色素 P450 系统代谢。成年大鼠在最初接触幼鼠 (T1) 后立即以 10 和 30 mg/kg 腹腔注射; 施用 NS 1738, 随后暴露于同一只幼鼠 (T2) 2 小时后 (T2/T1) 的调查持续时间显著缩短比值分别为 0.69 $\pm$ 0.13 和 0.61 $\pm$ 0.07)[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (273.88 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.7388 mL	13.6938 mL	27.3875 mL
		5 mM	0.5478 mL	2.7388 mL	5.4775 mL
		10 mM	0.2739 mL	1.3694 mL	2.7388 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.85 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.85 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 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.85 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]. Timmermann DB, et al. An allosteric modulator of the alpha7 nicotinic acetylcholine receptor possessing cognition-enhancing properties in vivo. J Pharmacol Exp Ther. 2007 Oct;323(1):294-307.

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	2.7388 mL	13.6938 mL	27.3875 mL	68.4688 mL
	5 mM	0.5478 mL	2.7388 mL	5.4775 mL	13.6938 mL
	10 mM	0.2739 mL	1.3694 mL	2.7388 mL	6.8469 mL
	15 mM	0.1826 mL	0.9129 mL	1.8258 mL	4.5646 mL
	20 mM	0.1369 mL	0.6847 mL	1.3694 mL	3.4234 mL
	25 mM	0.1096 mL	0.5478 mL	1.0955 mL	2.7388 mL
	30 mM	0.0913 mL	0.4565 mL	0.9129 mL	2.2823 mL
	40 mM	0.0685 mL	0.3423 mL	0.6847 mL	1.7117 mL
	50 mM	0.0548 mL	0.2739 mL	0.5478 mL	1.3694 mL
	60 mM	0.0456 mL	0.2282 mL	0.4565 mL	1.1411 mL



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: shyysw@sina.com

	80 mM	0.0342 mL	0.1712 mL	0.3423 mL	0.8559 mL
	100 mM	0.0274 mL	0.1369 mL	0.2739 mL	0.6847 mL



源叶