



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: **TCN 201**
CAS 号: **852918-02-6**
产品货号: **S87939**

生物活性:

Description	TCN 201 是一种有效的, 选择性和非竞争性的 GluN1/GluN2A NMDA 受体拮抗剂, pIC50 值为 6.8。与 GluN1/GluN2B NMDA 受体 (pIC50<4.3) 相比, TCN 201 对 GluN1/GluN2A NMDA 受体具有选择性。																									
IC50 & Target	pIC50: 6.8 (GluN1/GluN2A NMDA receptor)[1]																									
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description																						
	HEK-293T	IC ₅₀	109 nM	Negative allosteric modulation of eGFP-fused human GluN2A receptor expressed in HEK293T cells assessed as inhibition of NMDA-induced channel current at -60 mV holding potential measured for 5 secs every 60 secs in presence of glycine by whole cell patch c																						
In Vitro	TCN 201 (compound 1) is selective for GluN1/GluN2A NMDAR over GluN1/GluN2B NMDAR, with pIC50s of 6.8 and <4.3, respectively[1]. TCN 201 (10 μ M) produces only slight inhibition of GluN1/GluN2B NMDAR-mediated currents in oocytes[2]. TCN 201 (10-30 μ M) antagonism of NMDAR-mediated responses is both subtype- and glycine-dependent and more potent than TCN 213 in oocytes[2]. TCN 201 (0.1-100 μ M) does not produce complete block of NMDAR-mediated responses in oocytes[2]. TCN 201 (10 μ M) antagonism of NMDAR-mediated currents shows a negative correlation with their ifenprodil sensitivity in rat cortical neurons[2]. TCN 201 (1-9 μ M) suppresses cortical spreading depression (CSD) in chick retina[3].																									
In Vivo	TCN-201 (10 mg/kg; i.p.) is ineffective in CSD blood-oxygen level-dependent (BOLD) response in rats[4].																									
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (541.25 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) <table><tr><th rowspan="2">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent Mass Concentration</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><th></th><th></th><th></th><th></th></tr><tr><td rowspan="3"></td><td>1 mM</td><td>2.1650 mL</td><td>10.8251 mL</td><td>21.6502 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.4330 mL</td><td>2.1650 mL</td><td>4.3300 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2165 mL</td><td>1.0825 mL</td><td>2.1650 mL</td></tr></table> *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; 该产品在溶液状态不稳定, 建议您现用现配, 即刻使用。 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				Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg						1 mM	2.1650 mL	10.8251 mL	21.6502 mL	5 mM	0.4330 mL	2.1650 mL	4.3300 mL	10 mM	0.2165 mL	1.0825 mL	2.1650 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																						
	1 mM	2.1650 mL	10.8251 mL	21.6502 mL																						
	5 mM	0.4330 mL	2.1650 mL	4.3300 mL																						
	10 mM	0.2165 mL	1.0825 mL	2.1650 mL																						



	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: ≥ 2.08 mg/mL (4.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.50 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Bettini E, et, al. Identification and characterization of novel NMDA receptor antagonists selective for NR2A- over NR2B-containing receptors. J Pharmacol Exp Ther. 2010 Dec; 335(3): 636-44. [2]. Edman S, et, al. TCN 201 selectively blocks GluN2A-containing NMDARs in a GluN1 co-agonist dependent but non-competitive manner. Neuropharmacology. 2012 Sep; 63(3): 441-9. [3]. Bu F, et, al. NR2A contributes to genesis and propagation of cortical spreading depression in rats. Sci Rep. 2016 Mar 22;6:23576. [4]. Shatillo A, et, al. Involvement of NMDA receptor subtypes in cortical spreading depression in rats assessed by fMRI. Neuropharmacology. 2015 Jun; 93:164-70.

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; 该产品在溶液状态不稳定, 建议您现用现配, 即刻使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1650 mL	10.8251 mL	21.6502 mL	54.1254 mL
	5 mM	0.4330 mL	2.1650 mL	4.3300 mL	10.8251 mL
	10 mM	0.2165 mL	1.0825 mL	2.1650 mL	5.4125 mL
	15 mM	0.1443 mL	0.7217 mL	1.4433 mL	3.6084 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: shyyssw@sina.com

	20 mM	0.1083 mL	0.5413 mL	1.0825 mL	2.7063 mL
	25 mM	0.0866 mL	0.4330 mL	0.8660 mL	2.1650 mL
	30 mM	0.0722 mL	0.3608 mL	0.7217 mL	1.8042 mL
	40 mM	0.0541 mL	0.2706 mL	0.5413 mL	1.3531 mL
	50 mM	0.0433 mL	0.2165 mL	0.4330 mL	1.0825 mL
	60 mM	0.0361 mL	0.1804 mL	0.3608 mL	0.9021 mL
	80 mM	0.0271 mL	0.1353 mL	0.2706 mL	0.6766 mL
	100 mM	0.0217 mL	0.1083 mL	0.2165 mL	0.5413 mL



源叶