



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: **MK-801 (Dizocilpine)**

CAS 号: **77086-21-6**

产品货号: **S88179**

生物活性:				
Description	Dizocilpine (MK-801), 一种有效的抗惊厥剂, 是一种选择性非竞争性 NMDA 受体拮抗剂, Kd 为 37.2 nM。Dizocilpine 通过与 NMDA 相关离子通道内的一个位点结合而起作用, 从而阻止 Ca ²⁺ 的流动。			
IC50 & Target	NMDA Receptor			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	MCF7	GI ₅₀	> 300 μ M	Cytotoxicity against human MCF7 cells assessed as reduction in cell viability after 48 hrs by SRB assay
	SK-BR-3	GI ₅₀	> 300 μ M	Cytotoxicity against human SK-BR-3 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs by SRB assay
In Vitro	Dizocilpine (MK-801) 可逐渐抑制 NMDA 诱导的电流。Mg²⁺ (10 mM) 可阻止 Dizocilpine 阻断 N-Me-D-Asp 诱导的电流, 即使在 NMDA 存在下长期使用亦是如此。Dizocilpine 可阻断外向外斑块中 NMDA 激活的单通道活性[3]。 Dizocilpine (MK-801; <500 μM) 可抑制 LPS 诱导的小胶质细胞活化, 并增加 BV-2 细胞中 Cox-2 蛋白的表达。Dizocilpine (<500 μM) 可降低小胶质细胞 TNF-α 的输出, 在 BV-2 细胞中的 EC50 为 400 μM[4]。			
In Vivo	注意: 请勿仅参考一篇文章来确定实验条件。建议在正式实验前, 通过预实验确定最佳实验条件 (动物品系、年龄、剂量、频率及周期、检测时间及指标等)。 Dizocilpine maleate 可用于构建精神分裂模型, 腹腔注射 0.2 mg/kg 在 SD 大鼠体内的半衰期为 52.31 分钟, AUC 为 3185.48 nM $\cdot$ min, 清除率为 34 nM[2]。 诱导精神分裂模型 致病原理 Dizocilpine maleate 诱导精神分裂的具体机制尚不清楚。一种假设是 Dizocilpine maleate 通过抑制 NMDA 致使谷氨酸能系统失调, 从而诱导精神分裂。 具体造模方法: 大鼠: Sprague-Dawley $\cdot$ 雄性 $\cdot$ adult $\cdot$ 250-300 g 给药方式: 0.4 mg/kg $\cdot$ 腹腔注射 $\cdot$ 单剂量 Note 造模成功指标 行为: 自发活动增加并伴有明显的焦虑样行为, 具体表现为较远距离运动活动增加 (多动), 在中心区停留时间减少 (回避中心区)。 前脉冲抑制 (PPI): PPI 显著降低。 迷宫测试: 在高架十字迷宫测试中表现为避免进入开阔臂, 在 Y 迷宫测试中表现为减少进入新臂。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (451.88 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)			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg 10 mg



	Preparing Stock Solutions	1 mM	4.5188 mL	22.5938 mL	45.1875 mL
		5 mM	0.9038 mL	4.5188 mL	9.0375 mL
		10 mM	0.4519 mL	2.2594 mL	4.5188 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, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 5 mg/mL (22.59 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 50.0 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 5 mg/mL (22.59 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 50.0 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: ≥ 5 mg/mL (22.59 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 50.0 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]. Wong EH, et al. The anticonvulsant MK-801 is a potent N-methyl-D-aspartate antagonist. Proc Natl Acad Sci U S A. 1986 Sep;83(18):7104-8. [2]. Wegener N, et al. Evaluation of brain pharmacokinetics of (+)MK-801 in relation to behaviour. Neurosci Lett. 2011 Sep 26;503(1):68-72. [3]. Huettner JE, et al. Block of N-methyl-D-aspartate-activated current by the anticonvulsant MK-801: selective binding to open channels. Proc Natl Acad Sci U S A. 1988 Feb;85(4):1307-11. [4]. Thomas DM, et al. MK-801 and dextromethorphan block microglial activation and protect against				



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

	methamphetamine-induced neurotoxicity. Brain Res. 2005 Jul 19;1050(1-2):190-8. [5]. Brown TE, et al. The NMDA antagonist MK-801 disrupts reconsolidation of a cocaine-associated memory for conditioned place preference but not for self-administration in rats. Learn Mem. 2008 Dec 2;15(12):857-65.
--	---

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, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.5188 mL	22.5938 mL	45.1875 mL	112.9688 mL
	5 mM	0.9038 mL	4.5188 mL	9.0375 mL	22.5938 mL
	10 mM	0.4519 mL	2.2594 mL	4.5188 mL	11.2969 mL
	15 mM	0.3013 mL	1.5063 mL	3.0125 mL	7.5313 mL
	20 mM	0.2259 mL	1.1297 mL	2.2594 mL	5.6484 mL
	25 mM	0.1808 mL	0.9038 mL	1.8075 mL	4.5188 mL
	30 mM	0.1506 mL	0.7531 mL	1.5063 mL	3.7656 mL
	40 mM	0.1130 mL	0.5648 mL	1.1297 mL	2.8242 mL
	50 mM	0.0904 mL	0.4519 mL	0.9038 mL	2.2594 mL
	60 mM	0.0753 mL	0.3766 mL	0.7531 mL	1.8828 mL
	80 mM	0.0565 mL	0.2824 mL	0.5648 mL	1.4121 mL
	100 mM	0.0452 mL	0.2259 mL	0.4519 mL	1.1297 mL