



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: **Radiprodil**
CAS 号: **496054-87-6**
产品货号: **S88678**

生物活性:

Description	Radiprodil (RGH-896) 是具有口服活性的、NMDA 受体 NR2B 亚类的选择性拮抗剂。Radiprodil 有潜力用于神经性疼痛和其它慢性疼痛的相关研究。				
IC50 & Target	NMDA NR2B[1].				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	IC ₅₀	69.91 nM	Antagonist activity against NR1a/NR2B receptor transfected in human HEK293 cells assessed as inhibition of NMDA-induced Ca2+ influx	
In Vitro	Preincubation with Radiprodil (10 nM) restores long-term potentiation (LTP) in the presence of Aβ1-42, 3NTyr10-Aβ and Aβ1-40, but not AβpE3[2]. As for LTP, Radiprodil (10 nM) reverses the synaptic toxicity of 3NTyr-AβAβ1-40 and Aβ1-42 but not that AβpE3-42[2].				
In Vivo	Radiprodil could block NMDA currents in Mg2+ insensitive variants, with potencies similar to those obtained without Mg2+[3]. Radiprodil's potency is higher at pH 7.0 than at pH 7.6, suggesting that radiprodil may retain its ability to block glutamate-induced NMDA currents even under acidic conditions that manifest under long term seizures[3].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (629.09 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	2.5164 mL	12.5818 mL	25.1636 mL
		5 mM	0.5033 mL	2.5164 mL	5.0327 mL
		10 mM	0.2516 mL	1.2582 mL	2.5164 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.23 mM); 澄清溶液					



	此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$（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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (5.23 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$（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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (5.23 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$（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]. Mony L, et al. Allosteric modulators of NR2B-containing NMDA receptors: molecular mechanisms and therapeutic potential. Br J Pharmacol. 2009 Aug;157(8):1301-17. [2]. Rammes G, et al. The NMDA receptor antagonist Radiprodil reverses the synaptotoxic effects of different amyloid-beta (Aβ) species on long-term potentiation (LTP). Neuropharmacology. 2018 Sep 15;140:184-192. [3]. Mullier B, et al. GRIN2B gain of function mutations are sensitive to radiprodil, a negative allosteric modulator of GluN2B-containing NMDA receptors. Neuropharmacology. 2017 Sep 1;123:322-331.				
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	2.5164 mL	12.5818 mL	25.1636 mL	62.9089 mL
	5 mM	0.5033 mL	2.5164 mL	5.0327 mL	12.5818 mL
	10 mM	0.2516 mL	1.2582 mL	2.5164 mL	6.2909 mL
	15 mM	0.1678 mL	0.8388 mL	1.6776 mL	4.1939 mL
	20 mM	0.1258 mL	0.6291 mL	1.2582 mL	3.1454 mL
	25 mM	0.1007 mL	0.5033 mL	1.0065 mL	2.5164 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

	30 mM	0.0839 mL	0.4194 mL	0.8388 mL	2.0970 mL
	40 mM	0.0629 mL	0.3145 mL	0.6291 mL	1.5727 mL
	50 mM	0.0503 mL	0.2516 mL	0.5033 mL	1.2582 mL
	60 mM	0.0419 mL	0.2097 mL	0.4194 mL	1.0485 mL
	80 mM	0.0315 mL	0.1573 mL	0.3145 mL	0.7864 mL
	100 mM	0.0252 mL	0.1258 mL	0.2516 mL	0.6291 mL



源叶