



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: ICA 110381

CAS 号: 325457-99-6

产品货号: S87705

生物活性:

Description	ICA 110381 是一种具有口服活性的 Kv7.2/Kv7.3 (KCNQ2/3) 钾通道开放剂, 具有抗惊厥特性。 ICA 110381 是 KCNQ2/Q3 激动剂 (EC50=0.38 μM) 以及 KCNQ1 拮抗剂 (IC50=15 μM)。				
IC50 & Target[1]	KV7.1 0.38 μM (EC50)	KV7.3 0.38 μM (EC50)	KV7.1 15 μM (IC50)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	CHO	EC50	0.38 μM	Agonist activity at KCNQ2/KCNQ3 expressed in CHO cells assessed as increase in KCl-induced 86Rb+ efflux incubated for 10 mins prior to KCl-induction by liquid scintillation counting	
	CHO	IC50	15 μM	Antagonist activity at KCNQ1/MINK expressed in CHO cells assessed as inhibition of KCl-induced 86Rb+ efflux incubated for 10 mins prior to KCl-induction by liquid scintillation counting	
In Vitro	ICA 110381 在使用表达 KCNQ2 或 KCNQ3 的 CHO 细胞的激动剂诱导的铷流出测定中诱导铷流出 (EC50 = 0.38 μM)。ICA 110381 抑制表达 KCNQ1 的 CHO 细胞的铷流出 (EC50 = 15 μM)[1]。 在 CA1 锥体细胞中, ICA 110381 存在时 M 电流 (IM) 的增加通过降低输入电阻并将静息膜电位向超极化方向移动而导致神经元兴奋性减弱[2]。				
In Vivo	ICA 110381 (3-30 mg/kg; 口服; 一次) 可提高杏仁核完全点燃的大鼠诱导后放电的阈值, 并降低癫痫发作的严重程度和持续时间[2]。				
	Animal Model:		Female Wistar rats (200-300 g)[2]		
	Dosage:		3 mg/kg, 10 mg/kg and 30 mg/kg (suspended in 0.5% Hydroxyethyl Cellulose (HY-B2221B))		
	Administration:		Oral administration; once		
	Result:		Showed anticonvulsive properties in fully amygdala-kindled rats.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (467.97 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	10 mg
		1 mM	3.7438 mL	18.7189 mL	37.4378 mL
		5 mM	0.7488 mL	3.7438 mL	7.4876 mL
	10 mM	0.3744 mL	1.8719 mL	3.7438 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 (protect from light)。-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。				
	[1]. Amato G, et al. N-Pyridyl and Pyrimidine Benzamides as KCNQ2/Q3 Potassium Channel Openers for				



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

参考文献	the Treatment of Epilepsy. ACS Med Chem Lett. 2011 Mar 31;2(6):481-4. [2]. A Boehlen, et al. The new KCNQ2 activator 4-Chlor-N-(6-chlor-pyridin-3-yl)-benzamid displays anticonvulsant potential. Br J Pharmacol. 2013 Mar;168(5):1182-200.
------	--

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 (protect from light)。-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	3.7438 mL	18.7189 mL	37.4378 mL	93.5944 mL
	5 mM	0.7488 mL	3.7438 mL	7.4876 mL	18.7189 mL
	10 mM	0.3744 mL	1.8719 mL	3.7438 mL	9.3594 mL
	15 mM	0.2496 mL	1.2479 mL	2.4959 mL	6.2396 mL
	20 mM	0.1872 mL	0.9359 mL	1.8719 mL	4.6797 mL
	25 mM	0.1498 mL	0.7488 mL	1.4975 mL	3.7438 mL
	30 mM	0.1248 mL	0.6240 mL	1.2479 mL	3.1198 mL
	40 mM	0.0936 mL	0.4680 mL	0.9359 mL	2.3399 mL
	50 mM	0.0749 mL	0.3744 mL	0.7488 mL	1.8719 mL
	60 mM	0.0624 mL	0.3120 mL	0.6240 mL	1.5599 mL
	80 mM	0.0468 mL	0.2340 mL	0.4680 mL	1.1699 mL
	100 mM	0.0374 mL	0.1872 mL	0.3744 mL	0.9359 mL