



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: 利诺吡啶  
CAS 号: 105431-72-9  
产品货号: Y59958

生物活性:

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                           |           |            |            |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------|-----------|------------|------------|
| Description                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | Linopirdine (DuP 996) is an orally active, selective M-type K+ current (IM; Kv7; KCNQ Channels) inhibitor with an IC50 of 2.4 μM. Linopirdine is a TRPV1 agonist. Linopirdine, a putative cognition enhancing agent, increases acetylcholine release in rat brain tissue[1][2][3].                                             |                                           |           |            |            |
| IC50 & Target                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | IC50: 2.4 μM (M-type K+ current)[1]                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                           |           |            |            |
| In Vitro                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | Linopirdine (DuP 996) 抑制 IC (作为中等超极化尾电流测量, ImAHP), IC50 为 16.3 μM。Linopirdine (100 μM) 弱抑制 K+ 漏电流 IL、瞬态外向电流 IA、延迟整流器 IK 和 IAHP 的慢分量, 分别为 28、37、36 和 52 百分比。混合的 Na+/K+ 内向整流电流 IQ 基本上不受 Linopirdine (IC50>300 μM)[1]。Linopirdine 是 TRPV1 (瞬时受体电位香草酸 1 型) 的激动剂[3]。                                                                |                                           |           |            |            |
| In Vivo                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | Linopirdine (DuP 996; 静脉注射; 0.1-6 mg/kg; 增加剂量) 瞬时 (10-15 分钟) 和剂量依赖性增加 MAP 高达 15%[2]。<br>Animal Model: Male Sprague-Dawley rats (300-350 g)[2]<br>Dosage: 0.1, 0.5, 1, 3, 6 mg/kg<br>Administration: 5 intravenous bolus injections of increasing doses<br>Result: Transiently and dose-dependently increases MAP by up to 15%. |                                           |           |            |            |
| Solvent&Solubility                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 细胞实验:<br>DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (319.32 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                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | <div>Solvent / Mass / Concentration</div> | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | 1 mM                                      | 2.5545 mL | 12.7727 mL | 25.5454 mL |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | 5 mM                                      | 0.5109 mL | 2.5545 mL  | 5.1091 mL  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                | 10 mM                                     | 0.2555 mL | 1.2773 mL  | 2.5545 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。<br>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。<br>动物实验:<br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br>方案 一<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline<br>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.31 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>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。 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                           |           |            |            |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.31 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>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。</p> <p>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.31 mM); 澄清溶液</p> <p>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。</p> <p>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。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Schnee ME, et al. Selectivity of linopirdine (DuP 996), a neurotransmitter release enhancer, in blocking voltage-dependent and calcium-activated potassium currents in hippocampal neurons. J Pharmacol Exp Ther. 1998 Aug;286(2):709-17.</p> <p>[2]. Nassoioy SP, et al. Kv7 voltage-activated potassium channel inhibitors reduce fluid resuscitation requirements after hemorrhagic shock in rats. J Biomed Sci. 2017 Jan 17;24(1):8.</p> <p>[3]. Neacsu C, et al. The M-channel blocker linopirdine is an agonist of the capsaicin receptor TRPV1. J Pharmacol Sci. 2010;114(3):332-40.</p>                                                          |

#### 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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 2.5545 mL | 12.7727 mL | 25.5454 mL | 63.8635 mL |
|      | 5 mM             | 0.5109 mL | 2.5545 mL  | 5.1091 mL  | 12.7727 mL |
|      | 10 mM            | 0.2555 mL | 1.2773 mL  | 2.5545 mL  | 6.3863 mL  |
|      | 15 mM            | 0.1703 mL | 0.8515 mL  | 1.7030 mL  | 4.2576 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1277 mL | 0.6386 mL  | 1.2773 mL  | 3.1932 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1022 mL | 0.5109 mL  | 1.0218 mL  | 2.5545 mL  |
|      | 30 mM            | 0.0852 mL | 0.4258 mL  | 0.8515 mL  | 2.1288 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0639 mL | 0.3193 mL  | 0.6386 mL  | 1.5966 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|  |               |           |           |           |           |
|--|---------------|-----------|-----------|-----------|-----------|
|  | <b>50 mM</b>  | 0.0511 mL | 0.2555 mL | 0.5109 mL | 1.2773 mL |
|  | <b>60 mM</b>  | 0.0426 mL | 0.2129 mL | 0.4258 mL | 1.0644 mL |
|  | <b>80 mM</b>  | 0.0319 mL | 0.1597 mL | 0.3193 mL | 0.7983 mL |
|  | <b>100 mM</b> | 0.0255 mL | 0.1277 mL | 0.2555 mL | 0.6386 mL |



源叶