



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

产品名称: **NP118809**
产品别名: **39-1B4**

生物活性:

Description	NP118809 is a potent N-type calcium channel blocker, with an IC ₅₀ of 0.11 μM; also less potently inhibits L-type calcium channel with an IC ₅₀ of 12.2 μM.				
IC ₅₀ & Target	N-Type Ca ²⁺ Channel		L-type calcium channel		
	0.11 μM (IC ₅₀)		12.2 μM (IC ₅₀)		
In Vitro	NP118809 is a potent N-type calcium channel blocker, with an IC ₅₀ of 0.11 μM; also inhibits L-type calcium channel with an IC ₅₀ of 12.2 μM. NP118809 inhibits the hERG potassium channel in HEK cells, with an IC ₅₀ of 7.4 μM[1].				
In Vivo	NP118809 (25 mg/kg, i.p.) shows significant analgesic activity in the phase IIA portions of the rat formalin model[1]. NP118809 (30 mg/kg, p.o.) results in 80.3% inhibition of mechanical allodynia and 96.3% inhibition of thermal hyperalgesia in the rat spinal nerve ligation model[2].				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 50 mg/mL (108.55 mM; Need ultrasonic) H₂O : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1710 mL	10.8552 mL	21.7103 mL
		5 mM	0.4342 mL	2.1710 mL	4.3421 mL
		10 mM	0.2171 mL	1.0855 mL	2.1710 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℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。				
	In Vivo: 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				
	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline				
	Solubility: 2.5 mg/mL (5.43 mM); Suspended solution; Need ultrasonic and warming				
	此方案可获得 2.5 mg/mL (5.43 mM)的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。				
	以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。				
2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.43 mM); Clear solution					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.43 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。					



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

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。 3. 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% corn oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.43 mM); Clear solution 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (5.43 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Zamponi GW, et al. Scaffold-based design and synthesis of potent N-type calcium channel blockers. Bioorg Med Chem Lett. 2009 Nov 15;19(22):6467-72. [2]. Pajouhesh H, et al. Structure-activity relationships of diphenylpiperazine N-type calcium channel inhibitors. Bioorg Med Chem Lett. 2010 Feb 15;20(4):1378-83.

源叶生物