



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: **Lorediplon**
产品别名: **Lorediplon**

生物活性:				
Description	Lorediplon is a novel non-benzodiazepine, hypnotic drug acting as a GABAA receptor modulator, differentially active at the alpha1-subunit, associated with promoting sleep. Target: GABA Lorediplon is a drug for the treatment of insomnia, has been successfully completed with a best-in-class efficacy profile in terms of maintaining sleep and sleep quality, Lorediplon targets GABAA. [1] Lorediplon demonstrates a minimum of 10-fold and 6-fold increase in potency (respectively) in the spontaneous motor activation studies. At concentrations of 1.2mg/kg, Lorediplon demonstrates a 57%increased effect on Slow Wave Sleep (SWS), when compared with a placebo.[2]			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 100 mg/mL (253.54 mM; Need ultrasonic)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.5354 mL	12.6768 mL
		5 mM	0.5071 mL	2.5354 mL
		10 mM	0.2535 mL	1.2677 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 (6.34 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.34 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 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 (6.34 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.34 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 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。			
	[1]. Zisapel N. Current Phase II investigational therapies for insomnia. Expert Opin Investig Drugs. 2015			



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

References

Mar;24(3):401-411.

[2]. Horoszok L, et al. A single-dose, randomized, double-blind, double dummy, placebo and positive-controlled, five-way cross-over study to assess the pharmacodynamic effects of lorediplon in a phase advance model of insomnia in healthy Caucasian adult male s



源叶生物