

## 尼索地平 ; Nisoldipine

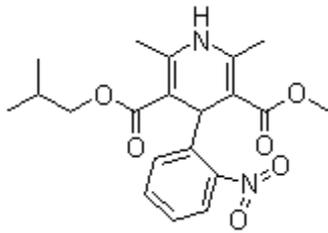
产品编号 : MB1270

质量标准 : &gt;98.5%

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 黄色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>20</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>6</sub>	结构式	
分子量	388.42		
CAS No.	63675-72-9		
储存条件	常温密闭避光防潮		
溶解性 (25°C)	DMSO :77 mg/mL (198.24 mM) Ethanol:60 mg/mL warmed (154.47 mM) 易溶于丙酮、三氯甲烷 不溶于水		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

### 物理性状及指标 :

外观 : .....黄色结晶性粉末

熔点 : .....148~152°C

溶解性 : .....易溶于丙酮、三氯甲烷 ; DMSO :77 mg/mL ; Ethanol:60 mg/mL warmed ; 不溶于水

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....≥98.5%

 IC<sub>50</sub> : .....半数致死剂量 (LD<sub>50</sub>) 经口 - 大鼠 - 1,257 mg/kg

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Nisoldipine 是特定 L 型 Ca <sub>v</sub> 1.2 钙通道阻断剂, IC <sub>50</sub> 为 10 nM。
<b>特性</b>	Nisoldipine 属于二氢吡啶(DHP),是最广泛使用的钙离子通道阻断剂(CCBs)。
<b>靶点</b>	L-type Cav1.2 10 nM
<b>体外研究</b>	Nisoldipine 是有效的 L 型钙离子阻断剂。和其他 DHP CCBs 类似, Nisoldipine 直接与失活的钙通道结合, 维持失活状态。Nisoldipine 选择性作用于动脉平滑肌, 因为失活通道和通道的 alpha-1 亚基更多。Nisoldipine 作用于豚鼠心室肌细胞, 延迟整流 K <sup>+</sup> 通道比 L 型 Ca <sup>2+</sup> 通道选择性低 30 倍, 抑制 IK <sub>r</sub> (快速激活延迟整流 K <sup>+</sup> 通道), IC <sub>50</sub> 为 23 μM, 及 IK <sub>s</sub> (缓慢激活延迟整流 K <sup>+</sup> 通道), IC <sub>50</sub> 为 40 μM。Nisoldipine 也显示抗氧化效果, IC <sub>50</sub> 为 28.2 μM, 通过非酶的产活性氧系统 (DHF/FeCl <sub>3</sub> -ADP)形成小鼠膜脂过氧化。
<b>体内研究</b>	Nisoldipine 通过抑制钙离子从 L 型钙通道流入, 降低动脉平滑肌收缩性及随后的血管收缩, 导致血管舒张, 且降低血压, 所以, Nisoldipine 用于治疗中度原发性高血压, 慢性稳定型心绞痛, 及变异性心绞痛。Nisoldipine 用于治疗 Timothy 综合征病人, 在 Ca <sub>v</sub> 1.2 错义突变 G406R 方面有效, IC <sub>50</sub> 为 267 nM。

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。尼索地平抑制平滑肌的电压依赖跨膜钙离子流，对血管平滑肌有高度选择性作用，扩张周围血管与冠状血管，由于冠状动脉扩张而改善氧供，减少后负荷而减少氧耗。治疗剂量无心肌负性作用并不影响心脏产生激动和传导，并有一定利尿钠作用。长期治疗并不产生耐受性。

**储液配置**

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5746 mL	12.8730 mL	25.7460 mL
5 mM	0.5149 mL	2.5746 mL	5.1492 mL
10 mM	0.2575 mL	1.2873 mL	2.5746 mL
50 mM	0.0515 mL	0.2575 mL	0.5149 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>激酶实验：</b>	<b>电流生理性结合实验：</b> 表达电压依赖的 L 型 $Ca^{2+}$ 通道亚基的 CHO 细胞培养在无血清，但是含有不同浓度 Nisoldipine 的培养基中。使用 List EPC-7 膜片钳软件通过膜片钳技术保持电位为 -100 mV 或 -50 mV，在室温下记录电流值，而引 $Ca^{2+}$ 通道。测定 IC50 值。
<b>细胞实验：</b>	<b>Cell lines:</b> 心室肌细胞 <b>Concentrations:</b> 溶于 DMSO, 终浓度为 10-100 $\mu$ M <b>Incubation Time:</b> 8-10 分钟 <b>Method:</b> 肌细胞在正常 Tyrode' s 溶液中温育，保持在 -80 mV, 200-ms 预脉冲(-40mV) 后去极化，500 ms 正电位为 0.1 Hz, 尾部为 -40mV。 10-100 mM Nisoldipine 处理肌细胞 8-10 分钟。使用 EPC-7 放大器记录全部细胞膜。
<b>动物实验：</b>	<b>Animal Models:</b> 胃部长期用酒精处理的雄性 Wistar 鼠 <b>Formulation:</b> 溶于 DMSO，在盐水稀释 <b>Dosages:</b> 10 mg/kg <b>Administration:</b> 每天口服处理

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。