

Flupirtine maleate ; 马来酸氟吡汀

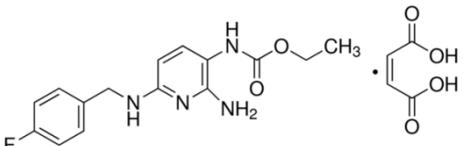
产品编号：MB1451

质量标准：>98%,BR

包装规格：20MG ; 100MG

产品形式：粉末

基本信息

分子式	C15H17FN4O2·C4H4O4	结构式	
分子量	420.39		
CAS No.	75507-68-5		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 84 mg/mL (199.81 mM)		
	Ethanol 2 mg/mL warmed (4.75 mM)		
	Water Insoluble		
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。		

简介 氟吡汀马来酸 Flupirtine (D 9998)马来酸盐是神经元钾通道开放剂,同时具有 NMDA 受体拮抗剂特性。

别名：2-Amino-6-[[[4-fluorophenyl)methyl]amino]-3-pyridinyl]-carbamic acid ethyl ester maleate salt

物理性状及指标：

外观：.....类白色粉末

熔点：.....185-188°C

溶解性：.....DMSO 84 mg/mL (199.81 mM);Ethanol 2 mg/mL warmed (4.75 mM);Water Insoluble

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....>98.0%

IC50：.....恶性疟原虫：IC50 = 2.00 μM; Apaf-1: IC50 = 26.6 μM (人)

.....葡萄糖-6-磷酸脱氢酶-6-磷酸葡萄糖酸内酯酶：IC50 = 3.00 μM (伯氏疟原虫);

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Flupirtine maleate 是 Flupirine 的盐形式，是一种非阿片类中枢性镇痛药，是一种选择性的神经元钾离子通道开放剂，也具有 NMDA 受体拮抗剂特性。
靶点	NMDA receptor Potassium channel
体外研究	Flupirtine 阻断 NMDA 和 gp120 HIV-1 诱导的大鼠皮层神经元细胞死亡。Flupirtine 浓度为 1-10 mM 时,通过降低钙离子浓度,而保护初级神经细胞免受谷氨酸钠诱导的毒性。Flupirtine 浓度为 1 或 5μg/mL 时,作用于初级神经细胞,阻断 β-淀粉样蛋白(25-35)诱导的凋亡。Flupirtine 浓度为 10 μM 作用于, 10 mM L-谷氨酸处理的 PC 12 培养中,显著降低非受体-调节的坏死细胞死亡,同时,Flupirtine 作用于 PC 12 培养,具有抗氧化效果。Flupirtine

	浓度为 1 μ M 和 10 μ M 时,降低 TRAIL 调节的人类活脑组织培养死亡。氟吡汀激活内向整流钾离子通道,从而使静息膜电位稳定在治疗相关的浓度。
体内研究	Flupirtine 对海马和纹状体神经元损伤具有保护作用。在动物研究中, Flupirtine 集中处理,抑制化学,热学,机械,和电刺激诱导的神经痛反应。Flupirtine 作用于大鼠,具有放松肌肉的效果。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB21169	氟吡汀盐酸盐-d4
---------	-----------

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。马来酸氟吡汀为选择性神经元钾通道开放剂, 是一种作用于中枢神经系统的非阿片类镇痛药, 不产生依赖性和耐受性。马来酸氟吡汀激活神经细胞膜上 G 蛋白偶联的 K⁺通道, K⁺外流稳定静息膜电位, 细胞膜活性降低; 从而间接抑制了 NMDA 受体的激活。治疗浓度的马来酸氟吡汀不与 α 1、 α 2、5HT1、5HT2、多巴胺、阿片、中枢 M 和 N 受体结合。马来酸氟吡汀对中枢神经系统主要有三种作用: 镇痛作用选择性地开放神经细胞非电压依赖型 K⁺通道, K⁺外流, 静息膜电位趋于稳定, 神经元不易兴奋。这种对 NMDA 受体的间接拮抗作用, 使 Ca²⁺内流减少, 因细胞内 Ca²⁺浓度升高所致的敏感效应得到缓冲。这样, 神经元兴奋状态下伤害性疼痛冲动传导受到抑制。肌松作用在治疗浓度下, 线粒体对 Ca²⁺的摄取作用增强了上述镇痛作用。这可能与抑制运动神经元和中间神经元的神经冲动传导引起肌松作用有关, 但这种肌松作用主要是肌张力下降。对疼痛迁延化(Chronification processes)的影响 疼痛迁延化实际上是因神经元的重塑所致的神经传导疾病。细胞内病变诱导神经元功能的重塑, 通过所谓的“发条(Wind-up)”机制加强了对随后冲动的反应。NMDA 受体对于激发这种变化具有特殊意义(基因表达)。马来酸氟吡汀对 NMDA 受体的间接阻断是一种抑制作用, 抵消了迁延性疼痛。如果疼痛已迁延, 那么细胞膜电位的稳定会逐渐消除疼痛记忆并减少疼痛的敏感性。

储液配置:

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3787 mL	11.8937 mL	23.7874 mL
5 mM	0.4757 mL	2.3787 mL	4.7575 mL
10 mM	0.2379 mL	1.1894 mL	2.3787 mL
50 mM	0.0476 mL	0.2379 mL	0.4757 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: PC12 细胞</p> <p>Concentrations: 1 或 5μg/mL</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 为了测定活性氧中间体的活力和产量, PC12 细胞按 10⁵ 个细胞/mL 接种在聚-L-赖氨酸包被的 24 或 96 孔板上。药物溶解在 PBS (pH 7.4) 或乙醇中, 然后无菌过滤。实验末期, 细胞胰蛋白酶化, 然后与培养上清液中的细胞一起制成颗粒。使用 0.2% 台酚蓝溶液染色 10 分钟, 在血细胞计数器测定活细胞(未染色)和死细胞(台酚蓝阳性)。此外, 通过 MTT 还原为甲臜而测评细胞活力。与 MTT(0.5 mg/ml)在 37$^{\circ}$C 下温育 2 小时后, 细胞溶解在 DMSO 中。使用光度板在 570 nm 处测定消光度。为了对存活的粘附细胞进行染色, 实验板与溶于 20% 甲醇的 0.5% 结晶紫温育 10 分钟。使用水清洗实验板, 染色的细胞溶于 50%乙醇, 0.1 M 柠檬酸钠, 然后在 550 nm 处测定消光度。</p>
动物实验	Animal Models: 四-血管-梗塞导致脑缺血的雄性 Wistar 大鼠

Formulation: 无菌 0.9%氯化钠溶液 Dosages: 5 mg/kg Administration: 梗塞 50 分钟后或 20 分钟前腹腔注射，或者直接梗塞 70 分钟后腹腔注射

【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。