

# SB705498

产品编号: MB3634

质量标准: >98%,hTRPV1 拮抗剂

包装规格:5MG;25MG 产品形式:powder

#### 基本信息

分子式	C17H16BrF3N4O		
分子量	429.23		
CAS No.	501951-42-4	结	
储存条件	-20℃,避光防潮密闭干燥	构	
冷却从	DMSO: 86 mg/mL (200.35 mM)	式	O N CE
溶解性 (25°C)	Water : Insoluble		N N N N N N N N N N N N N N N N N N N
(23 C)	Ethanol : 20 mg/mL (46.59 mM)		Br ''
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:**SB-705498 是一种有效的,选择性的,可口服的 TRPV1 拮抗剂,pIC<sub>50</sub> 值为 7.1。 **别名:**(R)-1-(2-bromophenyl)-3-(1-(5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl)pyrrolidin-3-yl)urea;

(R) - 1 - (2 - bromophenyl) - 3 - (1 - (5 - (trifluoromethyl)pyridin - 2 - yl)pyrrolidin - 3 - yl)urea

## 物理性状及指标:

外观:.....白色至类白色粉末

溶解性:.....DMSO:86 mg/mL(200.35 mM); Water:Insoluble; Ethanol:20 mg/mL(46.59 mM)

含量:.....>98%

储存条件:-20℃,避光防潮密闭干燥

生物活性

	SB705498 是一种 hTRPV1 拮抗剂 , 抑制 TRPV1 的 Capsaicin , 酸和热激活 , IC50 分别为 3 nM 📗
产品描述	0.1 nM 和 6 nM,该作用具有一定的电压依赖性,作用于 TRPV1 比作用于 TRPM8 选择性高 100
	倍以上。
靶点	hTRPV1 hTRPV1
#C <i>I</i> III	7.6(pKi) 7.1(pIC50)
	SB705498(0.3 nM-1 μM)有效抑制辣椒素诱导的在 1321N1 细胞或 HEK293 细胞中表达的人
	TRPV1 的活化 ,表观 pKi 分别为 7.5 或 7.6。100 nM SB705498 快速 ,完全且可逆地抑制 HEK293
	细胞中表达的 hTRPV1。SB705498 对毒蕈碱乙酰胆碱受体激活产生的 HEK293 细胞中内源性
	[Ca2+]响应没有显著作用,细胞内 Ca2+泵抑制剂毒胡萝卜素储存耗尽后,卡巴胆碱或钙库操纵性
体外研究	钙通道介导的 Ca2+流入。SB705498 (10 pM-1 μM)对密切相关的,在 HEK293 细胞中瞬时表达
P#71 WIJU	的 TRPV1 受体横向同源物 TRPV4 也没有显著的拮抗作用 ,其通过合成配体 4α-佛波酯-12,13-二
	癸酸酯(10 μM)激活。SB705498 对大鼠和豚鼠 TRPV1 显示出良好的拮抗作用。SB705498 对大
	鼠和豚鼠 TRPV1 产生拮抗作用的 pKi 分别为 7.5 和 7.3。对于维持稳态响应的辣椒素 ,100 nM-10
	μM SB705498 在-70 mV 下导致快速且完全的 hTRPV1 抑制。SB705498 抑制辣椒素介导的
	hTRPV1 活化,在正负控制电位(-70 mV 和+ 70 mV)下,IC50 分别为 3 nM 和 17 nM。1 μM

Fax:0086-411-66771945 Postcode:116600

Tel:400-659-9898 Email:sales@meilune.com



SB705498 在响应坪台期应用对 TRPV1 介导的传导性产生完全的,可逆的抑制。SB705498 对TRPV1 受体激活的多重不同的化学和物理模式表现出近似相等的活性。SB705498 对 hTRPV1 的高温和 pH 激活产生完全的阻断。

体内研究

SB705498 对 TRPV1 激活的多重模式,即辣椒素,热-和酸-介导的受体激活表现出有效可逆的阻断。SB705498 以 10 和 30 mg/kg 的剂量口服给药表现出良好的活性,并逆转痛觉超敏。SB705498以 10 mg/kg 的剂量口服给药,在豚鼠 FCA 模型中逆转 80%的痛觉超敏。

# 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)

MB3635 SB-366791
------------------

**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。SB-705498是一种有效的,选择性的,可口服的 TRPV1 拮抗剂,本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3298 mL	11.6488 mL	23.2975 mL
5 mM	0.4660 mL	2.3298 mL	4.6595 mL
10 mM	0.2330 mL	1.1649 mL	2.3298 mL
50 mM	0.0466 mL	0.2330 mL	0.4660 mL

## 【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。

Tel:400-659-9898 Fax:0086-411-66771945 Email:sales@meilune.com Postcode:116600



### 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

动物体系	<b>麦面积等效剂</b>	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。

Tel:400-659-9898 Fax:0086-411-66771945 Email:sales@meilune.com Postcode:116600