

A-803467; A803467

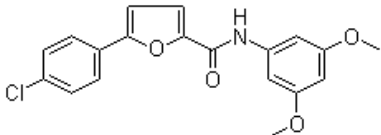
产品编号: MB3767

质量标准: >98%

包装规格: 10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C19H16ClNO4	结 构 式	
分子量	357.79		
CAS No.	944261-79-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 72 mg/mL (201.23 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 11 mg/mL (30.74 mM)		
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: A 803467 是 Nav1.8 钠离子通道阻断剂。

别名: 5-(4-(Chlorophenyl)-N-(3,5-dimethoxyphenyl)furan-2-carboxamide

物理性状及指标:

外观:白色至棕色固体

溶解性:DMSO: 72 mg/mL (201.23 mM); Water Insoluble; Ethanol: 11 mg/mL (30.74 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	A-803467 是选择性 Nav1.8 channel 抑制剂, IC ₅₀ 为 8 nM,抑制抗 Tetrodotoxin 的电流,比作用于人类 Nav1.2, Nav1.3, Nav1.5, 和 Nav1.7 选择性高 100 倍以上。
靶点	Nav1.8 通道
IC ₅₀	8 nM
体外研究	A-803467 有效阻挡重组人类或大鼠 Nav1.8 通道, IC ₅₀ 分别为 8 nM 和 45 nM,保持-40 mV 电位。处于静息电位时, A-803467 也有效阻断人类 Nav1.8 通路, IC ₅₀ 为 79 nM。A-803467 作用于大鼠背根神经节神经元阻断抗 Tetrodotoxin(TTX-R)的电流, 这种作用存在浓度依赖性, IC ₅₀ 为 140 nM,比 Mexiletine 和 Lamotrigine (IC ₅₀ >30 μM) 更有效。A-803467 作用于 hNav1.8 比作用于 hNav1.2, hNav1.3, hNav1.5, 和 hNav1.7 通道选择性高 300 到 1000 倍, IC ₅₀ 分别为 7.38 μM, 2.45 μM, 7.34 μM, 和 6.74 μM。A-803467 作用于周围感觉神经元通道和受体, 包括 TRPV1, P2X2/3, Cav2.2 和 KCNQ2/3 通道, 没有显著活性, IC ₅₀ >10 μM。A-803467 为 0.3 μM 而不是 0.1 μM 时, 显著抑制自发和电刺激诱发的动作电位产生。

体内研究	与体外作用于神经元动作电位的产电一致, A-803467 按 20 mg/kg 剂量静脉注射给药脊神经结扎大鼠,显著降低自发的和 von Frey hair 诱发的脊髓背角宽动态范围神经元, 分别降低 66%和 53%。A-803467 作用于多种大鼠疼痛模型, 包括脊神经结扎(ED50 = 47 mg/kg, 腹腔注射), 坐骨神经损伤(ED50 = 85 mg/kg, 腹腔注射),辣椒素引起的继发性机械性异常疼痛(ED50 ≈100 mg/kg, 腹腔注射), 和足底完全注射 Freund 佐剂后引起热痛觉过敏(ED50 = 41 mg/kg,腹腔注射), 也降低机械痛, 这种作用存在剂量依赖性。A-803467 对福尔马林诱导的伤害和急性热和术后疼痛, 以及化疗引起的疼痛模型 (Vincristine) 没有作用活性。
特征	A-803467 是第一个小分子钠离子通道阻断剂, 在钠离子通道家族中具有高效性和显著亚型-选择性。

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。本品 A-803467 是选择性 NaV1.8 channel 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7949 mL	13.9747 mL	27.9494 mL
5 mM	0.5590 mL	2.7949 mL	5.5899 mL
10 mM	0.2795 mL	1.3975 mL	2.7949 mL
50 mM	0.0559 mL	0.2795 mL	0.5590 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验:	Animal Models: 脊髓神经结扎, 坐骨神经损伤, 辣椒素引起的继发性机械性异常疼痛, 或足底完全注射 Freund 佐剂后引起热痛觉过敏的雄性 Sprague-Dawley 大鼠, 及雄性 CD1 小鼠 Formulation: 溶于 5% DMSO/95% PEG 400 Dosages: ~100 mg/kg Administration: 行为测验前 30 分钟腹腔注射
-------	--

【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。