

**Ivacaftor (VX-770) ; 依伐卡托(IVACAFTOR)**

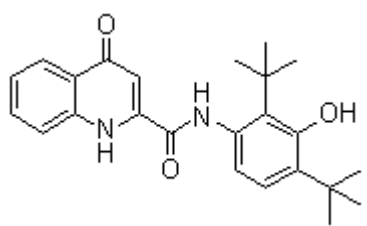
产品编号 : MB3809

质量标准 : &gt;98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

**基本信息**

分子式	C24H28N2O3	结 构 式	
分子量	392.49		
CAS No.	873054-44-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 78 mg/mL (198.73 mM) Water Insoluble Ethanol 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 :** 依伐卡托 Ivacaftor 是一种有效可口服的 CFTR 增效剂, 靶向 G551D-CFTR 和 F508del-CFTR。

**别名 :** **N-(5-Hydroxy-2,4-bis(2-methyl-2-propanyl)phenyl]-4-oxo-1,4-dihydro-3-quinolinecarboxamide, Cystic Fibrosis Transmembrane Conductance Regulator Potentiator, VX 770, Ivacaftor, Kalydeco**

**物理性状及指标 :**

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 78 mg/mL (198.73 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....&gt;98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥**生物活性**

<b>产品描述</b>	Ivacaftor 是囊性纤维化跨膜传导调节器(CFTR) 的增强剂, 靶向作用于 G551D-CFTR 和 F508del-CFTR, EC50 分别为 100 nM, 和 25 nM。	
<b>靶点</b>	G551D-CFTR	F508del-CFTR
<b>IC50</b>	100 nM	25 nM

<p><b>体外研究</b></p>	<p>Ivacaftor(10 μM) 作用于表达 CFTR 突变型 G551D 的 Fisher 大鼠甲状腺(FRT) 细胞, 显著提高 forskolin-刺激的 Cl-分泌(IT), 提高~4 倍, EC50 为 100 nM, 作用于表达 CFTR 突变型 F508del 进程的重组细胞, 提高 6 倍, EC50 为 25 nM。与提高 forskolin 刺激的 IT 相一致, Ivacaftor(10 μM) 提高 G551D-, F508del-, 和野生型 CFTR 的开放概率 (Po), 分别提高~6 倍,~5 倍 和~2 倍。说明 Ivacaftor 直接作用于 CFTR, 而提高活性。Ivacaftor(10 μM)作用于携带 G551D 和 F508del CFTR 突变型的原代培养的人 CF 支气管上皮细胞(HBE), 有效提高 forskolin-刺激的 IT, 提高 10 倍, 从 5%提高到最高水平 48%, EC50 为 236 nM, 有效性比通常使用的 CFTR 增强剂 Genistein 高 70 多倍, EC50 为 16 μM。Ivacaftor 作用于携带 F508del 纯合子 CFTR 的 HBE, 显著提高 forskolin 刺激的 IT, EC50 为 22 nM, 从 4%提高到 16%。因为 CFTR 增强, Ivacaftor 抑制过多 ENaC-调节的 Na+和液体吸收, IC50 为 43 nM,且作用于 G551D/F508del HBE, 降低 amiloride 反应, 导致表面液体和纤毛摆动频率(CBF)提高。</p>
<p><b>体内研究</b></p>	<p>Ivacaftor 作用于携带 G551D 突变的, 年龄 6 到 11 的囊性纤维化对象, 已经完成三期研究。</p>

**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)**

<p>MB3631</p>	<p>CFTRinh-172</p>
<p>MB3808</p>	<p>VX-661</p>

**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 Ivacaftor 是一种有效可口服的 CFTR 增效剂，靶向 G551D-CFTR 和 F508del-CFTR。可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

<p>体 质 浓度 积</p>	<p>1 mg</p>	<p>5 mg</p>	<p>10 mg</p>
<p>1 mM</p>	<p>2.5478 mL</p>	<p>12.7392 mL</p>	<p>25.4784 mL</p>
<p>5 mM</p>	<p>0.5096 mL</p>	<p>2.5478 mL</p>	<p>5.0957 mL</p>
<p>10 mM</p>	<p>0.2548 mL</p>	<p>1.2739 mL</p>	<p>2.5478 mL</p>
<p>50 mM</p>	<p>0.0510 mL</p>	<p>0.2548 mL</p>	<p>0.5096 mL</p>

**【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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体

产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。