

TRAM34 ; TRAM-34

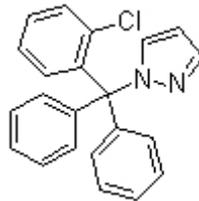
产品编号 : MB4140

质量标准 : >98%

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H17ClN2	结 构 式	
分子量	344.84		
CAS No.	289905-88-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 0.4 mg/mL (1.15 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 : TRAM-34 是一种选择性的钙激活 K⁺ 通道 (IKCa1) 阻断剂。

别名 : 1H-Pyrazole, 1-[(2-chlorophenyl)diphenylmethyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 0.4 mg/mL (1.15 mM); Water : Insoluble; Ethanol : Insoluble

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	TRAM-34 是一种有效的, 选择性的中电导 Ca ²⁺ -activated K ⁺ channel (IKCa1, KCa3.1) (钙激活的 K ⁺ 通道) 抑制剂, K _d 为 20 nM, 比作用于其他离子通道选择性高 200 到 1500 倍, 且不抑制细胞色素 P450。
特性	TRAM-34 具有与 Clotrimazole 相似的疗效, 但是缺乏其毒副作用。
靶点	IKCa1 (KCa3.1) 20 nM(Kd)
体外研究	与 Clotrimazole 不同, TRAM-34 选择性抑制 IKCa1 而不会阻断细胞色素 P450 酶(CYP3A4)。TRAM-34 有效抑制 IKCa1 转染的 COS-7 细胞中克隆的 IKCa1 通道, 也抑制人类 T 淋巴细胞和 T84 细胞中的 IKCa _d 电流, K _d 分别为 20 nM, 25 nM, 和 22 nM, 比 Clotrimazole 更有效, K _d 分别为 70 nM, 100 nM, 和 90 nM。TRAM-34 比其他离子通道, 如 K _v , BKCa _d , SKCa _d , Na ⁺ , CRAC 和 Cl ⁻ 通道选择性高 200 到 1500 倍。TRAM-34 显著抑制 anti-CD3 抗体或 PKC 激活剂 PMA 和钙离子载体离子霉素诱导的人类 T 淋巴细胞激活, IC50 分别为 295-910 nM 和 85-830 nM。TRAM-34 (5 μM) 不会抑制人类 T 淋巴细胞或一些细胞系的细胞活力。TRAM-34 显著抑制 EGF 诱导的 IKCa1 上调, 和 EGF 刺激的 A7r5 增殖, IC50 为 8 nM。TRAM-34 处理

	抑制人类子宫内膜癌(EC)细胞增殖,且阻断 EC 细胞周期,使其停在 G0/G1 期。TRAM-34 (1-30 μM)抑制 IKCa1 通道,导致 LNCaP 和 PC-3 前列腺癌(PCa) 细胞增殖受抑制,而不会导致凋亡,这种作用存在剂量依赖性,涉及 p21 ^{Cip1} 提高和细胞周期停滞在 G1 期。
体内研究	TRAM-34 按通道阻断剂量(0.5 mg/kg/day)500-1,000 倍处理小鼠 7 天,没有毒性。TRAM-34 每天按 120 mg/kg 剂量处理球囊导管损伤(BCI)的大鼠模型,显著降低内膜增殖,降低 ~40%。与体外抑制 EC 细胞增殖的效果相一致,在体内 TRAM-34 按 30 μM 处理减慢 HEC-1-A 肿瘤的进展。

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。TRAM-34 是一种有效的,选择性的中电导 Ca²⁺-activated K⁺ channel (IKCa1, KCa3.1) (钙激活的 K⁺通道) 抑制剂本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量			
	积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.8999 mL	14.4995 mL	28.9990 mL
5 mM		-	-	-
10 mM		-	-	-
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

电生理学:	
激酶实验	克隆人类 IKCa1 然后在 COS-7 细胞中表达。在膜片钳技术的全细胞中研究细胞。保持电位为 280 mV。内部移液管溶液含: 145 mM K ⁺ 天冬氨酸, 2 mM MgCl ₂ , 10 mM Hepes, 10 mM K ₂ EGTA, 和 8.5 mM CaCl ₂ (1 μM 游离 Ca ²⁺), pH 7.2, 290-310 mOsm。为了降低 COS-7 细胞中氯离子通道的电流,使用 Na ⁺ 天冬氨酸 Ringer 作为外部溶液: 160 mM Na ⁺ 天冬氨酸/4.5 mM KCl/2 mM CaCl ₂ /1 mM MgCl ₂ /5 mM Hepes, pH 7.4/290-310 mOsm。每隔 10 秒使用-120 mV 到 40 mV 的 200-ms 电压斜率诱导 COS-7 细胞中的 IKCa 电流,且 -80 mV 时 TRAM-34 降低的电导斜率用来衡量通道受抑制情况。
细胞实验	<p>Cell lines: 人类 T 淋巴细胞, Jurkat E6-1, MEL, C2F3, CHO, COS-7, L929, NGP, NLF, 和 RBL-2H3</p> <p>Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为 ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 使用 TRAM-34 处理细胞 48 小时。48 小时后通过抽吸 (悬浮细胞) 或胰蛋白酶消化 (粘附细胞) 收集细胞,离心,再悬浮在 0.5 mL 含 1 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 碘化丙啶(PI)的 PBS 中,使用 FACScan 流式细胞仪测定红色荧光。每个样品中分析 10⁴ 个细胞,通过测定 PI 摄取而测定死亡细胞百分数。</p>
动物实验	<p>Animal Models: Sprague-Dawley 大鼠</p> <p>Formulation: 在花生油中制备</p> <p>Dosages: 120 mg/kg/day</p>

Administration: 皮下注射

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做好预处理，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。