

PF3845 ; PF-3845

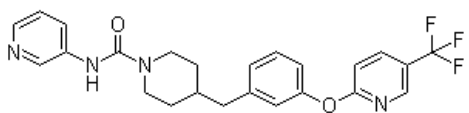
产品编号 : MB4298

质量标准 : >98% , 不可逆的 FAAH 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C24H23F3N4O2	结 构 式	
分子量	456.46		
CAS No.	1196109-52-0		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 91 mg/mL (199.36 mM) Water Insoluble Ethanol : 91 mg/mL (199.36 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 : PF-3845 是选择性脂肪酰胺水解酶 (FAAH) 抑制剂, 对 FAAH2 几乎无活性。

别名 : 1-Piperidinecarboxamide, N-3-pyridinyl-4-[[3-[[5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]oxy]phenyl]methyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 91 mg/mL (199.36 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 91 mg/mL (199.36 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	PF-3845 是有效的, 选择性, 不可逆的 FAAH 抑制剂, Ki 为 230 nM,对 FAAH2 几乎没有作用活性。
靶点	FAAH
IC50	230 nM (Ki)

体外研究	PF-3845 通过使 FAAH 的丝氨酸亲核试剂氨甲酰化而选择性抑制 FAAH。PF-3845 处理，导致 FAAH 处理的油酸酰胺水解的进展曲线发生弯曲，这与不可逆抑制机制相一致。PF-3845 按两步机制抑制 FAAH，包括 PF-3845 与 FAAH 的可逆结合，第二步化学步骤导致共价键的形成。结构和动力学研究显示，与之前描述的抑制剂(URB597, PF-750)相比，PF-3845 提高的效力，可能来源于范德瓦尔斯与疏水性 FAAH 酰基链结合通道。这种假设得到 SAR 数据支持，SAR 数据来源于一系列 PF-3845 联芳醚类似物，在类似物中引入活性严重受损的抑制剂的某些区域的极性基团。
体内研究	PF-3845 处理的小鼠(10 mg/kg,腹腔注射)，在脑中 FAAH 快速完全失活，通过竞争性活性为基础的蛋白谱(ABPP)与丝氨酸水解酶指向的探针氟磷酸盐(FP)-罗丹明。PF-持续长时间机能，高达 24 小时。PF-3845 处理的小鼠，脑中 AEA 和其他 NAEs 水平显著提高(>10 倍)。FAAH 是 AEA-降解酶脂肪酸酰胺水解酶。PF-3845(1-30 mg/kg,口服处理)抑制机械性疼痛，这种作用具有剂量依赖性，最低有效剂量(MED)为 3 mg/kg (PF-3845 处理大鼠 4 小时分析)。更高剂量(10 和 30 mg/kg)，PF-3845 同等程度抑制疼痛反应，程度比非甾体类抗炎药 Naproxen(10mg/kg,口服处理)强。PF-3845(10 mg/kg,腹腔注射)处理注射盐水的爪子，显著逆转 LPS 诱导的触觉异常疼痛。
特征	PF-3845 是 PF-750 衍生物，通过共价可逆机制抑制 FAAH，但是作用效果温和，与 PF-750 或研究充分的氨基甲酸酯 FAAH 抑制剂 URB597 相比，PF-3845 作用于 FAAH，Kinact/ Ki 值高 10 到 20 倍。

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)

MB4301	JNJ-1661010
MB4297	URB597

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。PF-3845 是选择性脂肪酰胺水解酶 (FAAH) 抑制剂，对 FAAH2 几乎无活性。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	2.1908 mL	10.9539 mL	21.9077 mL
5 mM	0.4382 mL	2.1908 mL	4.3815 mL
10 mM	0.2191 mL	1.0954 mL	2.1908 mL
50 mM	0.0438 mL	0.2191 mL	0.4382 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: 雄性 C57BL/6 小鼠 Formulation: PF-3845 通过超声和涡旋按 1 mg/ml 溶解到 18:1:1 v/v/v 盐水:乳化剂:乙醇混合物中 Dosages: 10 mg/kg 或 1-30 mg/kg Administration: 腹腔注射或口服处理
-------------	---

【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(M ²)	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。