

VX-765; VX765; Belnacasan

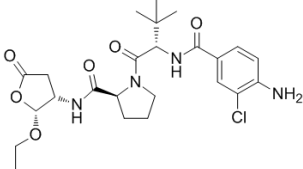
产品编号: MB4573

质量标准: >98%,caspase-1 抑制剂

包装规格: 10MG; 50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C24H33ClN4O6	结构式	
分子量	509		
CAS No.	273404-37-8		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 100 mg/mL (196.46 mM)		
	Water Insoluble		
	Alcohol 100 mg/mL (196.46 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: Belnacasan (VX-765)是一种有效的选择性 caspase-1 抑制剂。

别名:

(S)-1-((S)-2-(4-amino-3-chlorobenzamido)-3,3-dimethylbutanoyl)-N-((2R,3S)-2-ethoxy-5-oxo-tetrahydrofuran-3-yl)pyrrolidine-2-carboxamide

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO 100 mg/mL (196.46 mM);Water Insoluble;Alcohol 100 mg/mL (196.46 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Belnacasan (VX-765)是一种有效的选择性 caspase-1 抑制剂, 无细胞试验中 K_i 为 0.8 nM。Phase 2。	
特性	一种有效的选择性白介素-转化酶/半胱天冬酶-1 抑制剂。	
靶点	Caspase-4 (Cell-free assay)	Caspase-1 (Cell-free assay)

	<0.6 nM(Ki)	0.8 nM(Ki)
体外研究	VX-765 是一种口服可吸收的 VRT-043198 前药，其对 ICE/caspase-1 和 caspase-4 表现出有效的抑制作用，Ki 分别为 0.8 nM 和 <0.6 nM。VRT-043198 也会抑制 IL-1 β 从 PBMCs 和全血中的释放，IC50 分别为 0.67 μ M 和 1.9 μ M。	
体内研究	在胶原诱导的关节炎小鼠模型中，VX-765 (200 mg/kg) 抑制 60% LPS 诱导的 IL-1 β 产生，并导致炎症比例剂量依赖性显著减少，对关节病变也能够产生有效保护作用。在体内，VX-765 通过防止前脑星形胶质细胞中 IL-1 β 的增加阻断大鼠体内的癫痫发生，而对后放电持续时间没有显著影响。在急性癫痫小鼠模型中，VX-765 (50 mg/kg-200 mg/kg) 通过延迟首次癫痫开始时间，并减少平均 50% 的癫痫发作次数以及 64% 的总持续时间，产生抗痉挛作用。在患有遗传性失神癫痫的成年大鼠体内，VX-765 药物注射 3 天后，通过选择性阻断 IL-1 β 生物合成，显著降低累积持续时间和平均 55% 的棘慢波放电(SWDs)。	

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。Belnacasan (VX-765) 是一种有效的选择性 caspase-1 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.9646 mL	9.8232 mL
5 mM	0.3929 mL	1.9646 mL	3.9293 mL
10 mM	0.1965 mL	0.9823 mL	1.9646 mL
50 mM	0.0393 mL	0.1965 mL	0.3929 mL

经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）

动物实验	Animal Models: 胶原诱导性关节炎小鼠模型。 Formulation: VX-765 溶解在 25% 聚氧乙烯蓖麻油中。 Dosages: \leq 200 mg/kg Administration: 口服给药
------	--

【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, 请选择合适溶剂, 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。