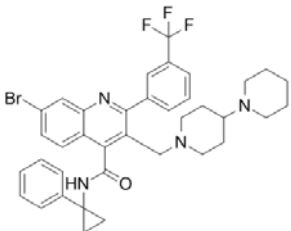


## GSK2193874

产品编号：MB5965  
 质量标准：≥98%,BR  
 包装规格：5MG;  
 25MG产品形式：粉末

### 基本信息

分子式	C37H38BrF3N4O	结 构 式	
分子量	691.62		
CAS No.	1336960-13-4		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：100 mg/mL (144.58 mM)		
	Water：insoluble		
	Ethanol：50 mg/mL warmed (72.29 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：**GSK2193874 是具有口服活性的有效的选择性 TRPV4 拮抗剂，作用于 rTRPV4 和 hTRPV4，IC<sub>50</sub> 分别为 2 nM 和 40 nM。

### 别

**名：**3-([1,4'-Bipiperidin]-1'-ylmethyl)-7-bromo-N-(1-phenylcyclopropyl)-2-[3-(trifluoromethyl)phenyl]-4-quinolinecarboxamide

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL (144.58 mM);Ethanol 50 mg/mL warmed (72.29 mM);Water Insoluble

含量：.....≥98%

**储存条件：**常温，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	GSK2193874 是一种具有口服活性的、有效的、选择性 transient receptor potential vanilloid 4 (TRPV4) 阻滞剂，对 hTRPV4 和 rTRPV4 的 IC <sub>50</sub> 分别为 0.04 和 0.002 μM。	
<b>靶点</b>	rTRPV4 (Cell-free assay)	hTRPV4 (Cell-free assay)
	0.002 μM	0.04 μM
<b>体外研究</b>	GSK2193874 拮抗 TRP 通道，对靶点的抑制作用相对对 TRPV1、TRPA1、TRPC3、TRPC6 和 TRPM8 的作用来说更具有选择性。用 GSK2193874 处理人脐静脉内皮细胞(HUVECs)可浓度依赖性地阻止细胞收缩以及抑制由 GSK1016790 激活 TRPV4 所导致的细胞脱离。	

<b>体内研究</b>	在大鼠和犬类中检测 GSK2193874 的药代动力学，发现在慢性动物模型中，GSK2193874 具有适于口服途径的半衰期和其他特性。（在大鼠中：iv CL = 7.3 mL/min/kg, po t1/2 = 10 h, %F = 31；在狗中：iv CL = 6.9 mL/min/kg, po t1/2 = 31 h, %F = 53）。除此之外，在大鼠中，当 GSK2193874 浓度高达 30 mg/kg 时，对血压或心率没有作用。在一些心衰模型中，GSK2193874 能够改善肺功能。在急性和慢性心衰模型中，GSK2193874 的预处理可抑制肺水肿的形成并增强动脉氧合。GSK2193874 能够维持内皮细胞的完整性、抑制内皮 TRPV4 电流，在离体肺和心衰模型中保护肺部免于肺水肿形成。
-------------	---

**美仑相关产品推荐**

MB5966	GSK1016790A (GSK101)
--------	----------------------

**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。GSK2193874 是 TRPV4 离子通道(IC50 = 50nm)的一种强效特异性拮抗剂。肺静脉高压(PVP)引起的肺水肿是由 TRPV4 活动引起的。GSK2193874 阻断了表达原代和重组 TRPV4 的细胞中 TRPV4 介导的钙内流，抑制了高 PVP 条件下分离的啮齿动物和犬肺血管通透性和肺水肿。该化合物还可以缓解小鼠心肌梗死模型中的肺水肿。

**储液配置：**

体 DMSO 质 浓度 积 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.4459 mL	7.2294 mL	14.4588 mL
5 mM	0.2892 mL	1.4459 mL	2.8918 mL
10 mM	0.1446 mL	0.7229 mL	1.4459 mL
50 mM	0.0289 mL	0.1446 mL	0.2892 mL

**经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）**

<b>细胞实验</b>	<b>Cell lines:</b> 稳定转染 hTRPV4 的 HEK 细胞(CG27)HUVECs <b>Concentrations:</b> 1-30 nM(extracellularly); 0.03-10 uM(intracellularly) <b>Incubation Time:</b> -- <b>Method:</b> 在细胞外，将 GSK2193874(1-30 nM)加入培养基中进行处理；在细胞内，通过将 GSK2193874(0.03-10 μM)加入电极液中进行处理。在-60 和+60 mV 之间引出斜坡电流，在 GSK634775 (100 nM)激活 TRPV4 后，检测+60 mV 处峰值输出电流。在 HUVECs 中，在-80 和+80 mV 之间引出斜坡电流，在 GSK2193874 (300 nM)处理后，加入 GSK1016790 (30 nM)激活 TRPV4，检测+60 mV 处峰值输出电流。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 成年雄性 SD 大鼠 <b>Formulation:</b> 6% Cavitron <b>Dosages:</b> 30 mg/kg <b>Administration:</b> 口服填喂

**【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。