

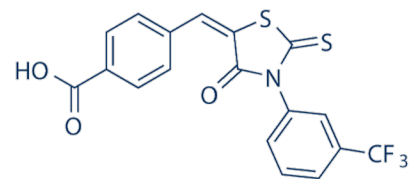
CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF9110-10mM	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF9110-5mg	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	5mg
SF9110-25mg	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-[(2-chlorophenyl)-diphenylmethyl]pyrazole
简称	CFTRinh 172
别名	CFTR Inhibitor-172, CFTR(inh)-172, ChEMBL461939, ST50148666
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₁₀ F ₃ NO ₃ S ₂
分子量	409.4
CAS号	307510-92-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 82mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.22ml DMSO, 或每4.09mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF9110-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	CFTRinh-172是电势差不依赖性的选择性CFTR抑制剂, Ki为300nM, 对于MDR1、ATP敏感性钾离子通道或者一系列的转运蛋白没有效果。				
信号通路	Transmembrane Transporters				
靶点	CFTR	—	—	—	—
IC50	300nM(Ki)	—	—	—	—
体外研究	CFTRinh-172时间和剂量依赖性的抑制了CFTR介导的碘离子转运, 也有效地抑制了多种激动剂或者活化剂介导的CFTR的激活。作为一个选择性的CFTR通道抑制剂, CFTRinh-172也能够完全阻断兔泪腺的腺泡和导管细胞中氯离子的流通。CFTRinh-172以不依赖于CFTR的机制, 诱导了ROS的产生, 线粒体的损伤以及NF-κB信号通路的激活。				
体内研究	CFTRinh-172(20μg/6h)在不影响霍乱弧菌体内增殖的情况下能够完全阻碍霍乱弧菌诱导的肠道液体分泌。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	实验使用筛选工作站, 检测500±10nM激发波长/535±15nM发射波长的荧光光谱。首先PBS清洗板孔三次, 并留下50μl PBS。加入10μl CFTR活化液(5μM forskolin, 100μM IBMX, 25μM apigenin in PBS), 五分钟后, 加入10μM的待测化合物(0.5μl的1mM DMSO solution)。再过十分钟, 先检测基线后检测碘代物荧光强度。

细胞实验	
细胞系	费舍尔大鼠甲状腺(FRT)细胞系
浓度	1mM左右
处理时间	24小时
方法	细胞毒性分析是通过在0-1000μM抑制剂中培养后用二氢罗丹明检测24小时。

动物实验

动物模型	霍乱弧菌引起的腹泻成年老鼠模型
配制	DMSO
剂量	20g/6h
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Ma T, et al. J Clin Invest. 2002, 110(11), 1651-1658.
- 2.Lu M, et al. Curr Eye Res. 2012, 37(8), 671-677.
- 3.Kelly M, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2010, 333(1), 60-69.
- 4.Sawasirojwong S, et al. PLoS Negl Trop Dis. 2013, 7(6), e2293.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF9110-10mM	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF9110-5mg	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	5mg
SF9110-25mg	CFTRinh 172 (CFTR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01