



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **BX 430**
CAS 号: **688309-70-8**
产品货号: **S89066**

生物活性:				
Description	BX430 是一种有效且选择性的非竞争性的人 P2X4 受体通道变构拮抗剂, IC50 为 0.54 μ M。BX430 具有物种特异性。BX430 用于慢性疼痛和心血管疾病。			
IC50 & Target	P2X4 Receptor			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HEK293	IC ₅₀	0.54 μ M	Antagonist activity at human P2X4R transfected in HEK293 cells assessed as inhibition of ATP-evoked current by patch clamp assay
	HEK293	IC ₅₀	1.3 μ M	Antagonist activity at human P2X4R transfected in HEK293 cells assessed as inhibition of ATP-mediated calcium influx measured after 10 mins by YOPRO-1 dye uptake assay
	HEK293	IC ₅₀	500 nM	Antagonist activity at human P2X4 receptor tranfected in human HEK293 cells at -60 mv holding potential by Whole cell patch-clamp method
	HEK293	IC ₅₀	780 nM	Antagonist activity at human P2X4 receptor tranfected in human HEK293 cells assessed as inhibition of ATP-induced calcium influx by Fluo2-AM staining based inverted fluorescence microscopic method
In Vitro	BX430 对其他所有 P2X 亚型(即 P2X1-P2X3、P2X5 和 P2X7)几乎没有功能性影响,即使浓度为其 IC ₅₀ 的 10-100 倍时也是如此[1]。 BX430 是斑马鱼 P2X4 的一种强效拮抗剂,但对大鼠和小鼠 P2X4 同源物无影响[1]。 在表达人类 P2X4 的细胞中,用他帕司尔加 BX430 共同处理可显著降低 ATP 引起的细胞内钙升高[1]。 BX430 (5 μ M) 显著降低 THP-1 细胞中 ATP 诱导的细胞内钙响应的幅度[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (201.71 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响,请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.4207 mL	12.1033 mL
		5 mM	0.4841 mL	2.4207 mL
		10 mM	0.2421 mL	1.2103 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时,请在 2 年内使用, -20°C 储存时,请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液,再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性,澄清的储备液可以根据储存条件,适当保存;体内实验的工作液,建			



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	请您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.03 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.03 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水电溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.03 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Ase AR, et al. Identification and characterization of a selective allosteric antagonist of human P2X4 receptor channels. Mol Pharmacol. 2015 Apr;87(4):606-16. [2]. Sophocleous RA, et al. Pharmacological and genetic characterisation of the canine P2X4 receptor. Br J Pharmacol. 2020 Feb 4.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80° C, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4207 mL	12.1033 mL	24.2066 mL	60.5166 mL
	5 mM	0.4841 mL	2.4207 mL	4.8413 mL	12.1033 mL
	10 mM	0.2421 mL	1.2103 mL	2.4207 mL	6.0517 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.1614 mL	0.8069 mL	1.6138 mL	4.0344 mL
	20 mM	0.1210 mL	0.6052 mL	1.2103 mL	3.0258 mL
	25 mM	0.0968 mL	0.4841 mL	0.9683 mL	2.4207 mL
	30 mM	0.0807 mL	0.4034 mL	0.8069 mL	2.0172 mL
	40 mM	0.0605 mL	0.3026 mL	0.6052 mL	1.5129 mL
	50 mM	0.0484 mL	0.2421 mL	0.4841 mL	1.2103 mL
	60 mM	0.0403 mL	0.2017 mL	0.4034 mL	1.0086 mL
	80 mM	0.0303 mL	0.1513 mL	0.3026 mL	0.7565 mL
	100 mM	0.0242 mL	0.1210 mL	0.2421 mL	0.6052 mL



源叶