



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: **BI-749327**
CAS 号: **2361241-23-6**
产品货号: **S89146**

生物活性:

Description	BI-749327 是一种高效、高选择性、有口服生物活性的 TRPC6 拮抗剂, 对小鼠、人、豚鼠 TRPC6 作用的 IC50 值分别为 13 nM、19 nM 和 15 nM。BI-749327 对小鼠 TRPC6 的选择性是 TRPC3 的 85 倍, 是 TRPC7 的 42 倍。				
IC50 & Target	IC50: 13 nM (mouse TRPC6), 19 nM (human TRPC6), 15 nM (guinea pig TRPC6)[1]				
In Vitro	BI-749327 可抑制表达野生型或获得功能 TRPC6 突变体的 HEK293T 细胞中的 NFAT 活化, 并阻断分离的肌细胞中相关的信号传导和促肥大基因的表达[1]。				
In Vivo	BI-749327 (30 mg/kg/天; 口服) 可改善左心功能, 降低体积/质量比, 并抑制持续压力超负荷小鼠的促纤维化基因表达和间质纤维化[1]。				
	BI-749327 剂量依赖性地降低单侧输尿管梗阻小鼠的肾纤维化和相关基因表达[1]。				
	BI-749327 对小鼠 (3-30 mg/kg; 口服) 具有较长的终末半衰期 (t1/2: 8.5-13.5 小时) [1]。				
	Animal Model:	C57BL/6J mice[1]			
	Dosage:	30 mg/kg/day			
	Administration:	Oral gavage			
	Result:	Improved left heart function, reduced volume/mass ratio, and blunted expression of profibrotic genes and interstitial fibrosis in mice subjected to sustained pressure overload.			
	Animal Model:	CD-1 mice[1]			
	Dosage:	3 mg/kg, 10 mg/kg, 30 mg/kg			
	Administration:	Oral administration			
	Result:	t1/2 8.5-13.5 hours			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 31.25 mg/mL (70.63 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	10 mg
		1 mM	2.2602 mL	11.3012 mL	22.6024 mL
		5 mM	0.4520 mL	2.2602 mL	4.5205 mL
		10 mM	0.2260 mL	1.1301 mL	2.2602 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, 建议您现用现配, 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 (4.70 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 (4.70 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 生理盐水水溶液 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 (4.70 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]. Lin B L, et al. In vivo selective inhibition of TRPC6 by antagonist BI 749327 ameliorates fibrosis and dysfunction in cardiac and renal disease. Proc Natl Acad Sci U S A. 2019 May 14;116(20):10156-10161.

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	2.2602 mL	11.3012 mL	22.6024 mL	56.5061 mL
	5 mM	0.4520 mL	2.2602 mL	4.5205 mL	11.3012 mL
	10 mM	0.2260 mL	1.1301 mL	2.2602 mL	5.6506 mL
	15 mM	0.1507 mL	0.7534 mL	1.5068 mL	3.7671 mL
	20 mM	0.1130 mL	0.5651 mL	1.1301 mL	2.8253 mL
	25 mM	0.0904 mL	0.4520 mL	0.9041 mL	2.2602 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: shyysw@sina.com

	30 mM	0.0753 mL	0.3767 mL	0.7534 mL	1.8835 mL
	40 mM	0.0565 mL	0.2825 mL	0.5651 mL	1.4127 mL
	50 mM	0.0452 mL	0.2260 mL	0.4520 mL	1.1301 mL
	60 mM	0.0377 mL	0.1884 mL	0.3767 mL	0.9418 mL



源叶