



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: **VU 0463271**

CAS 号: **1391737-01-1**

产品货号: **T87724**

生物活性:				
Description	VU0463271 is a selective KCC2 antagonist, with an IC50 of 61 nM.			
IC50 & Target	IC50: 61 nM (KCC2)[1].			
In Vitro	VU0463271 是神经元特异性氯化钾协同转运蛋白 2 (KCC2) 的有效拮抗剂, IC50 为 61 nM, 选择性是与其密切相关的 Na-K-2Cl 协同转运蛋白 1 的 100 倍以上 (NKCC1), 并且在更大的 GPCR、离子通道和转运蛋白组中没有活性。还发现它在体外迅速清除[1]。 将 VU0463271 应用于横切的 CNS 制剂, 1 μ M VU0463271 导致果蝇 CNS 的放电率显著增加, 从而导致 OR 和 rdl 菌株的峰值放电率分别比基线放电率高 2.7 倍和 2.5 倍[2]。 VU0463271 (10-100 nM) 导致大约在一小部分准备工作中, CNS 放电频率降低 20%[2]。			
In Vivo	发现 VU0463271 在大鼠 (CL=57 mL/min/kg) 静脉内给药 (1 mg/kg) 后是一种中度到高度清除的化合物; 稳态下的低分布容积 (Vss 0.4 L/kg), 加上中等到高的清除率, 在体内产生相对较短的 t1/2 (9 分钟)[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (65.36 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	2.6144 mL	13.0719 mL
		5 mM	0.5229 mL	2.6144 mL
		10 mM	0.2614 mL	1.3072 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 → 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.54 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。				
参考文献	[1]. Delpire E, et al. Further optimization of the K-Cl cotransporter KCC2 antagonist ML077: development of a highly selective and more potent in vitro probe. Bioorg Med Chem Lett. 2012 Jul 15;22(14):4532-5. [2]. Rui Chen, et al. Functional Coupling of K ⁺ -Cl ⁻ Cotransporter (KCC) to GABA-Gated Cl ⁻ Channels in			



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

the Central Nervous System of Drosophila melanogaster Leads to Altered Drug Sensitivities. ACS Chem Neurosci. 2019 Jun 19;10(6):2765-2776.

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	2.6144 mL	13.0719 mL	26.1438 mL	65.3595 mL
	5 mM	0.5229 mL	2.6144 mL	5.2288 mL	13.0719 mL
	10 mM	0.2614 mL	1.3072 mL	2.6144 mL	6.5359 mL
	15 mM	0.1743 mL	0.8715 mL	1.7429 mL	4.3573 mL
	20 mM	0.1307 mL	0.6536 mL	1.3072 mL	3.2680 mL
	25 mM	0.1046 mL	0.5229 mL	1.0458 mL	2.6144 mL
	30 mM	0.0871 mL	0.4357 mL	0.8715 mL	2.1786 mL
	40 mM	0.0654 mL	0.3268 mL	0.6536 mL	1.6340 mL
	50 mM	0.0523 mL	0.2614 mL	0.5229 mL	1.3072 mL
	60 mM	0.0436 mL	0.2179 mL	0.4357 mL	1.0893 mL