

Catalog Number: CM05988

产品信息

Catalog Number:
CM05988

CAS号:
448947-81-7

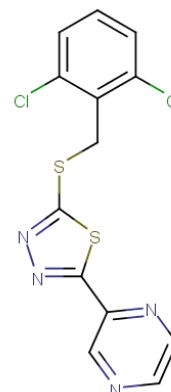
分子式:
C₁₃H₈Cl₂N₄S₂

主要靶点:
Piezo Channel

主要通路:
离子通道

分子量:
355.27

溶解度:
DMSO:28 mg/mL (80 mM);



靶点活性

Piezo1 (human, Piezo1-transfected HEK293T cells):26.6 μM|Piezo1 (Piezo1-transfected HEK293T cells):17.1 μM

体外活性

方法:瞬时转染小鼠和人 Piezo1 和 Piezo2 的 HEK293T 细胞用 Yoda 1 (0-100 μM) 处理, 通过 FLIPR 检测浓度响应曲线。**结果:**微摩尔浓度的 Yoda1 在转染了人或小鼠 Piezo1 的细胞中诱导了强烈的 Ca²⁺ 反应, 但在转染了 Piezo2 的细胞中没有, 表明其对 Piezo1 具有选择性。小鼠和人 Piezo1 的表现 EC50 分别为 17.1 μM 和 26.6 μM。[1] **方法:** HUVEC 细胞在恒定剪切应力为 5 dyn/cm² 的层流下或在 Yoda 1 (0.05-2 μM) 静态条件下培养 24 h, 通过 flow cytometry 检测 ICAM-1 或 VCAM-1 表面水平。**结果:**恒定剪切应力下的培养使 ICAM-1 的表面表达平均增加 1.77±0.19 倍, VCAM-1 没有增加。Yoda 1 治疗 24 h 模拟了这种反应, 诱导 ICAM-1 表面表达的浓度依赖性增加。1 μM Yoda 1 显著增加 ICAM-1 水平, 比对照高 1.45±0.11 倍, VCAM-1 表面表达不受影响。[2]

体内活性

方法:为研究对骨细胞的作用, 将 Yoda 1 (5 μmol/kg) 腹腔注射给 C57BL/6J 小鼠, 每周五次, 持续两周。**结果:**Yoda 1 没有改变体重, 但增加了股骨远端的皮质厚度和松质骨质量。Yoda 1 还增加了椎骨的皮质厚度, 没有检测到椎骨松质骨体积的变化。与对骨量的影响一致, Yoda 1 治疗的小鼠血清骨钙素 (一种骨形成标志物) 水平升高。Yoda 1 激活 Piezo1 模拟了流体剪切应力对骨细胞的影响, 并增加了小鼠的骨量。[3]

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.