

Catalog Number: CM06484

产品信息

Catalog Number:
CM06484

CAS号:
944261-79-4

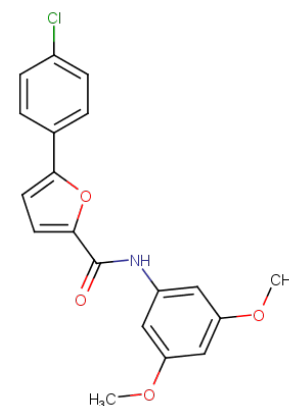
分子式:
C₁₉H₁₆ClNO₄

主要靶点:
Sodium Channel

主要通路:
离子通道

分子量:
357.79

溶解度:
Ethanol:8.9 mg/mL (24.87
mM);DMSO:65 mg/mL (181.67
mM)



靶点活性

Nav1.8 channel:8 nM

体外活性

A-803467剂量依赖性地降低了包括脊神经结扎 (ED₅₀ = 47 mg/kg,ip),坐骨神经损伤 (ED₅₀ = 85 mg/kg,ip),辣椒素 - 诱导的继发性机械性异常性疼痛 (ED₅₀=100 mg/ kg,腹腔注射) 和足底内完全弗氏佐剂注射后的热痛觉过敏 (ED₅₀ = 41 mg/kg,腹腔注射).与体外对神经元动作电位的影响一致,将A-803467 (20 mg/kg,iv) 全身给予脊神经结扎的大鼠,明显降低自发的和von Frey hair诱发的脊髓背角宽动态范围神经元,分别降低66%和53%.A-803467对福尔马林诱导的伤害和急性热和术后疼痛,以及化疗引起的疼痛模型 (长春新碱) 无效.

体内活性

A-803467以浓度依赖性方式阻断大鼠背根神经节神经元中的河豚毒素 - 抗性 (TTX-R) 电流,IC₅₀为140 nM,与美西律和拉莫三嗪 (IC₅₀> 30 μM) 相比更有效. A-803467对于hNav1.8显示比hNav1.2,hNav1.3,hNav1.5和hNav1.7通道高300倍至1,000倍的选择性,其IC₅₀分别为7.38 μM,2.45 μM,7.34 μM和6.74 μM. A-803467显示对外周感觉神经元 (包括TRPV1,P2X2/3,CaV2.2和KCNQ2/3通道) 中表达的其他通道和受体没有显著活性,IC₅₀> 10 μM. A-803467有效阻断重组人类或大鼠Nav1.8通道,IC₅₀分别为8 nM和45 nM,保持-40 mV电位.在静息状态下,A-803467也有效阻断人Nav1.8通道,IC₅₀为79 nM.

储存

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