

Catalog Number: CM06492

产品信息

Catalog Number:
CM06492

CAS号:
1262618-39-2

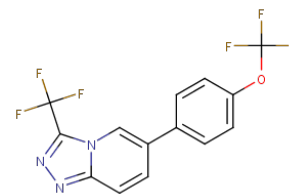
分子式:
C₁₄H₇F₆N₃O

主要靶点:
Sodium Channel

主要通路:
离子通道

分子量:
347.22

溶解度:
DMSO:50 mg/mL (144 mM)



靶点活性

Late INa:0.13 μ M

体外活性

GS967 (10、100、300纳摩尔) 完全抑制了ATX-II (10纳摩尔) 增加心肌细胞动作电位持续时间 (APD) 及APD变异性的效果, 表观IC₅₀值约为10纳摩尔, 且减少了APD的搏动间变异性[1]。

体内活性

GS967能防止和逆转晚期INa增强剂ATX-II及IKr抑制剂E-4031的致心律失常效应, 并显著减轻methoxamine 1 clofilium引起的致心律失常效应, 抑制缺血引起的心律失常[1]。GS967以频率依赖的方式减少INaP, 符合使用依赖性阻断(UDB)。GS967引发的INaP UDB(半抑制浓度IC₅₀=0.07 μ M)比ranolazine(16 μ M)和lidocaine(17 μ M)更强。GS967对典型的长QT综合征突变(delKPQ) [2]也表现出相同效应。GS967能阻止缺血引起的左心房和左心室alternans增加, 减少缺血引起的去极化异质性和复极化异质性增加。GS967不改变心率、动脉血压、PR间期和QT间期或QRS持续时间, 但在缺血期间轻度降低了心脏收缩性, 这与晚期INa抑制一致[3]。

储存

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