

Org-27569 ; Org 27569

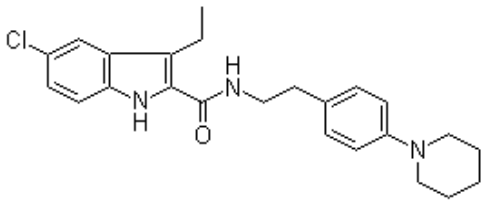
产品编号 : MB4263

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C24H28ClN3O	结构式	
分子量	409.95		
CAS No.	868273-06-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 82 mg/mL Water <1 mg/mL Ethanol <1 mg/mL		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : Org 27569 是有效的 CB1 receptor 别构调节剂, 既能增加激动剂与 CB1 结合, 又能抑制激动剂诱导的 CB1 信号通路。

别名 : 1H-Indole-2-carboxamide, 5-chloro-3-ethyl-N-[2-[4-(1-piperidinyl)phenyl]ethyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 82 mg/mL ; Water <1 mg/mL ; Ethanol <1 mg/mL

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Org 27569 是 cannabinoid CB1 receptor 变构调节剂, 通过增强激动剂亲和力而诱导 CB1 受体状态改变, 且降低逆向激动剂的亲和力。
特性	诱捕受体与不同的激动剂结合, 但没有构象状态的信号。
靶点	CB1

体外研究	Org 27569 是 CB1 大麻素受体的别构调节剂。它显著增加 CB1 受体与激动剂的结合，并显著降低 CB1 受体与反向激动剂的特异性结合。Org 27569 诱导 CB1 以高亲和力结合激动剂，受体内化，以及下游 ERK 磷酸化。变构配体 Org 27569 促进激动剂与 CB1 的结合，但是阻断 TM6 中的构象变化。Org 27569 诱捕受体与不同的激动剂结合，但没有构象状态的信号。
-------------	--

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3823	AM251
MB3822	BML-190
MB3754	GW842166X

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Org 27569 是 cannabinoid CB1 receptor 变构调节剂本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4393 mL	12.1966 mL	24.3932 mL
5 mM	0.4879 mL	2.4393 mL	4.8786 mL
10 mM	0.2439 mL	1.2197 mL	2.4393 mL
50 mM	0.0488 mL	0.2439 mL	0.4879 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>平衡结合试验。： 结合试验以 CB1 受体激动剂³H]CP 55,940 (0.7 nM)和 CB1 受体拮抗剂³H]SR 141716A (1.2 nM), 1 毫克/毫升 BSA 以及包含 0.1 mM EDTA 和 0.5 mM MgCl₂的 50 mM Tris 缓冲液, pH 7.4, 总试验体积为 500 微升进行。通过加入小鼠脑膜(30 微克)启动结合。试验在 37°C 下进行 60 分钟, 加入冰预冷的洗涤缓冲液(50 mM Tris 缓冲液和 1 毫克/毫升 BSA)而终止, 用在 4°C 下于洗涤缓冲液中浸泡 24 小时的 24 孔取样歧管和 Whatman GF/B 玻璃纤维过滤器过滤。每个反应试管用 4 毫升等分试样缓冲液清洗 5 次。过滤器在烘箱干燥 60 分钟, 然后放在 5 毫升闪烁液中, 放射性通过液体闪烁光谱法进行定量。特异性结合由 1μM 相应的未标记配体存在和不存在下结合的区别来定义, 总结合为 70%至 80%。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HEK293 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 5 到 15 分钟</p>

Method: 细胞表达 CB1 受体暴露于 ORG27569 (10 μ M) 5~15 分钟。Fortoxin 处理以消除 Gi 耦合作用, PTX 以 5 纳克/毫升加入培养基。随后在毒素存在下培养 18 小时, 细胞用 PBS 清洗两次, 用化合物处理。细胞用冰预冷的 PBS 洗涤, 细胞裂解物通过冰预冷的裂解缓冲液(150 mM NaCl, 1.0% IGEPAL CA-630, 0.5% 脱氧胆酸钠, 0.1% SDS, 以及 50 mM Tris, pH 7.5 包含 4-(2-氨基乙基)苯磺酰氟, 胃蛋白酶抑制剂 A, E-64, 苯丁抑制素, 亮抑酶肽, 以及抑肽酶作为蛋白酶抑制剂)处理获得。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂 (如 PBS) 稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确保 DMSO 的终浓度 <5%, 以避免毒性作用。给药剂量设计时候, 可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12

豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
> 1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。