

URB597

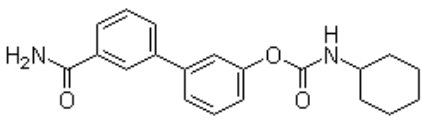
产品编号：MB4297

质量标准：>98%，FAAH 抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

| | | | |
|---------------|--|-------------|--|
| 分子式 | C ₂₀ H ₂₂ N ₂ O ₃ | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 338.4 | | |
| CAS No. | 546141-08-6 | | |
| 储存条件 | -20°C，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 68 mg/mL (200.94 mM) Water Insoluble Ethanol : 5 mg/mL (14.77 mM) | | |
| 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：URB597 是口服生物相容性的 FAAH 抑制剂，对其它的 cannabinoid-相关靶点无活性。

别名：KDS-4103；Carbamic acid, N-cyclohexyl-, 3'-(aminocarbonyl)[1,1'-biphenyl]-3-yl ester

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 68 mg/mL (200.94 mM)；Water Insoluble；Ethanol : 5 mg/mL (14.77 mM)

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 | URB597 (KDS-4103) 是口服生物有效的 FAAH 抑制剂，IC ₅₀ 为 4.6 nM, 对其他 cannabinoid 相关靶点没有抑制活性。 |
| 靶点 | FAAH |
| IC₅₀ | 4.6 nM |
| 体外研究 | URB597 结合到 FAAH 的是疏水口袋和催化核心区中，使活性位点残基连到 FAAH 的膜 |

| | |
|------|--|
| | <p>表面。URB597 作用于大鼠脑膜，抑制 FAAH 活性，IC50 为 4.6 nM。URB597 作用于人肝脏微粒体，抑制 FAAH 活性，IC50 为 3 nM。URB597 浓度为 10 μM 或 20 μM 时，作用于原代大鼠小胶质细胞，降低 LPS 诱导的酶环加氧酶 2(COX2) 和诱导型一氧化氮合酶 (iNOS; NOS2) 的表达，随后，炎性介质前列腺素 E2 (PGE2) 和一氧化氮 (NO) 的释放降低。URB597 浓度为 100 μM 时，引起 Ca²⁺ 进入短暂表达人或大鼠 TRPA1 基因的 HEK293-F 细胞。URB597 浓度为 200 μM 时，也激活 Ca²⁺ 进入表达 TRPA1 通道的大鼠 DRG 神经元。</p> |
| 体内研究 | <p>URB597 按 0.3 mg/kg 剂量腹腔注射处理给药大鼠脑膜，抑制[3H]anandamide 水解，通过抑制 FAAH，提高脑 anandamide, OEA, 和 PEA 含量。URB597 按 0.3 mg/kg 剂量腹腔注射处理，通过抑制 FAAH，增强乙醇胺诱导的低温效应。URB597 按 0.3 mg/kg 剂量作用于炎症疼痛性大鼠，通过大麻素 CB1 和 CB2 受体介导的镇痛，而降低异常性疼痛和痛觉过敏。URB597 每天按 0.3 mg/kg 剂量腹腔注射处理大鼠，持续 5 周，通过抑制脑 FAAH 活性，缓解慢性轻微应激诱导的体重增加和葡萄糖摄取降低。URB597 按 0.3 mg/kg 剂量腹腔注射处理雌性大鼠，可逆转大部分青春期 THC 处理而诱导的抑郁症样症状。</p> |

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)

| | |
|--------|-------------|
| MB4301 | JNJ-1661010 |
| MB4298 | PF-3845 |

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。URB597 是口服生物相容性的 FAAH 抑制剂，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 | 2.9551 mL | 14.7754 mL | 29.5508 mL |
| 5 mM | 0.5910 mL | 2.9551 mL | 5.9102 mL |
| 10 mM | 0.2955 mL | 1.4775 mL | 2.9551 mL |
| 50 mM | 0.0591 mL | 0.2955 mL | 0.5910 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|------|---|
| 激酶实验 | <p>药理研究: 从脑组织匀浆中制备膜组分，使用[³H]anandamide (anandamide[乙醇胺-³H], 60 Ci/mmol) 作为底物，测量 FAAH。大鼠脑膜(50 μg 蛋白) 在含[³H]anandamide 和多种浓度 URB597 的 buffer 中 37°C 下温育 30 min 分钟。温育末期，加入氯仿/甲醇混合物终止反应，然后通过液</p> |
|------|---|

| | |
|-------------|---|
| | 体闪烁计数器测定水相中的 ^[3H] 乙醇胺。 |
| 细胞实验 | <p>Cell lines: 原代大鼠小胶质细胞</p> <p>Concentrations: 10 μM 或 20 μM</p> <p>Incubation Time: 2 小时</p> <p>Method: 从 1-3 天大的仔鼠中制备小胶质细胞的磁隔离。在 37°C 下接种 4 小时后, 在有或无选择性 CB1 和 CB2 拮抗剂 SR141716A 和 SR144528, 或空白对照 (0.05% DMSO/0.06% 乙醇)存在时, 使用 10 或 20 μM URB597 处理细胞。使用化合物处理细胞 120 分钟, 然后加入 0.03 μg/ml 脂多糖 (LPS)。在 37°C 下维持 16 小时, 收集上清液用于生化分析。粘附在孔底的残留胶质细胞立刻用于测定 NO 产量。使用(DAF-FM 二乙酸酯), 在激发和发射波长分别为 490 nm 和 520 nm 时, 测定培养的小胶质细胞中释放的 NO。使用 ELISA 试剂盒分析前列腺素 E2 (PGE2) 和 TNF 水平。</p> |
| 动物实验 | <p>Animal Models: 成年雄性 Wistar 大鼠 (250–300 g) 和 C57/BL6 或 FAAH^{-/-} 小鼠</p> <p>Formulation: 无菌 0.9% NaCl 溶液</p> <p>Dosages: 0.3 mg/kg</p> <p>Administration: 皮下注射</p> |

【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。