



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: TRPM8 antagonist 2

CAS 号: 259674-19-6

产品货号: S87758

生物活性:

Description	TRPM8 antagonist 2 是一种有效的, 选择性的 TRPM8 拮抗剂, IC50 值为 0.2 nM, 可用于研究神经性疼痛综合症。				
IC50 & Target	IC50: 0.2 nM (TRPM8)[1].				
In Vitro	TRPM8 antagonist 2 (Compound 14) 是一种有效的选择性 TRPM8 拮抗剂, IC50 为 0.2 nM, 用于神经性疼痛综合征的研究。TRPM8 antagonist 2 在 Ca2+ 荧光测定中有效抑制薄荷醇诱导的细胞内 Ca2+ 水平升高, HEK293 细胞稳定表达 TRPM8 通道的大鼠亚型 (IC50, 40 nM)[1]。				
In Vivo	TRPM8 antagonist 2 (1、10 和 30 mg/kg, 皮下注射) 显示出显著的剂量依赖性镇痛活性, 并在 30 mg/kg 时抑制小鼠 wet-dog shakes (WDS) 样冷超敏反应 63%。此外, TRPM8 antagonist 2 (0.1 和 1 μg, 皮下注射) 可减轻 Oxaliplatin (OXp) 诱导的小鼠冷异常性疼痛[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (250.94 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5094 mL	12.5471 mL	25.0941 mL
		5 mM	0.5019 mL	2.5094 mL	5.0188 mL
		10 mM	0.2509 mL	1.2547 mL	2.5094 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.67 mg/mL (6.70 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 26.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.67 mg/mL (6.70 mM); 澄清溶液					



	此方案可获得 ≥ 2.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 26.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.67 mg/mL (6.70 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 26.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Bertamino A, et al. Identification of a Potent Tryptophan-Based TRPM8 Antagonist With in Vivo Analgesic Activity. J Med Chem. 2018 Jul 10. doi: 10.1021/acs.jmedchem.8b00545.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year. -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5094 mL	12.5471 mL	25.0941 mL	62.7353 mL
	5 mM	0.5019 mL	2.5094 mL	5.0188 mL	12.5471 mL
	10 mM	0.2509 mL	1.2547 mL	2.5094 mL	6.2735 mL
	15 mM	0.1673 mL	0.8365 mL	1.6729 mL	4.1824 mL
	20 mM	0.1255 mL	0.6274 mL	1.2547 mL	3.1368 mL
	25 mM	0.1004 mL	0.5019 mL	1.0038 mL	2.5094 mL
	30 mM	0.0836 mL	0.4182 mL	0.8365 mL	2.0912 mL
	40 mM	0.0627 mL	0.3137 mL	0.6274 mL	1.5684 mL
	50 mM	0.0502 mL	0.2509 mL	0.5019 mL	1.2547 mL
	60 mM	0.0418 mL	0.2091 mL	0.4182 mL	1.0456 mL
	80 mM	0.0314 mL	0.1568 mL	0.3137 mL	0.7842 mL
	100 mM	0.0251 mL	0.1255 mL	0.2509 mL	0.6274 mL