



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: **RHC-80267,二酰基甘油脂肪酶抑制剂**
CAS 号: **83654-05-1**
产品货号: **Y69191**

生物活性:

Description	RHC 80267 (U-57908) 是一种有效的选择性二酰基甘油酯酶 (DAGL) 抑制剂 (对犬血小板的 IC50 为 4 μM)。RHC 80267 抑制胆碱酯酶活性, IC50 为 4 μM, 从而增强了乙酰胆碱引起的松弛。RHC 80267 还抑制 COX 活性和磷脂酰胆碱的水解。				
IC50 & Target	IC50: 4 μM (Canine diacylglycerol lipase), 4 μM (Cholinesterase); COX; Phosphatidylcholine[1][3][4]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK-293T	IC50	> 100 μM	Inhibition of recombinant ABHD12 transfected in HEK293T cells by SDS-PAGE using rhodamine-tagged FP probe	
	HEK-293T	IC50	10 μM	Inhibition of recombinant KIAA1363 transfected in HEK293T cells by SDS-PAGE using rhodamine-tagged FP probe	
	HEK-293T	IC50	11 μM	Inhibition of recombinant PLA2g7 transfected in HEK293T cells by SDS-PAGE using rhodamine-tagged FP probe	
	HEK-293T	IC50	23 μM	Inhibition of recombinant BAT5 transfected in HEK293T cells by SDS-PAGE using rhodamine-tagged FP probe	
	HEK-293T	IC50	70 μM	Inhibition of recombinant FAAH transfected in HEK293T cells by SDS-PAGE using rhodamine-tagged FP probe	
In Vitro	RHC 80267 增强乙酰胆碱诱导的舒张作用可能是通过抑制胆碱酯酶引起的: (1) RHC 80267 不影响卡巴胆碱 (carbachol) 的反应, 卡巴胆碱是乙酰胆碱的氨甲酰衍生物, 其与乙酰胆碱的唯一区别是对胆碱酯酶水解具有耐受性; (2) RHC 80267 的作用可被胆碱酯酶抑制剂新斯的明 (neostigmine) 模仿, 而在最大有效浓度的新斯的明存在下, RHC 80267 无额外作用。对脑匀浆中胆碱酯酶活性测定的结果证实, RHC 80267 在与增强乙酰胆碱舒张作用相同的浓度范围内 (1-10 μM) 抑制该酶的活性 [2].				
In Vivo	RHC 80267 (40 μM) 在内皮依赖性机制下增强了 U46619 (一种血栓烷 A2 类似物) 在人肺动脉 (hPAs) 和大鼠肺动脉 (rPAs) 中, 以及血管紧张素 II (ANG II) 在大鼠肺动脉 (rPAs) 中引起的收缩[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (63.37 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	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5348 mL	12.6740 mL	25.3479 mL
		5 mM	0.5070 mL	2.5348 mL	5.0696 mL
		10 mM	0.2535 mL	1.2674 mL	2.5348 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Sutherland CA, et al. Relative activities of rat and dog platelet phospholipase A2 and diglyceride lipase. Selective inhibition of diglyceride lipase by RHC 80267. J Biol Chem. 1982 Dec 10;257(23):14006-10. [2]. Ghisda P, et al. The diacylglycerol lipase inhibitor RHC-80267 potentiates the relaxation to acetylcholine in rat mesenteric artery by anti-cholinesterase action. Eur J Pharmacol. 2005 Jul 4;517(1-2):97-102. [3]. Karpińska O, et al. Activation of CB1 receptors by 2-arachidonoylglycerol attenuates vasoconstriction induced by U46619 and angiotensin II in human and rat pulmonary arteries. Am J Physiol Regul Integr Comp Physiol. 2017 Jun 1;312(6):R883-R893. [4]. Oglesby TD, et al. The inhibition of arachidonic acid metabolism in human platelets by RHC 80267, a diacylglycerol lipase inhibitor. Biochim Biophys Acta. 1984 Apr 18;793(2):269-77.
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。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5348 mL	12.6739 mL	25.3479 mL	63.3697 mL
	5 mM	0.5070 mL	2.5348 mL	5.0696 mL	12.6739 mL
	10 mM	0.2535 mL	1.2674 mL	2.5348 mL	6.3370 mL
	15 mM	0.1690 mL	0.8449 mL	1.6899 mL	4.2246 mL
	20 mM	0.1267 mL	0.6337 mL	1.2674 mL	3.1685 mL
	25 mM	0.1014 mL	0.5070 mL	1.0139 mL	2.5348 mL
	30 mM	0.0845 mL	0.4225 mL	0.8449 mL	2.1123 mL
	40 mM	0.0634 mL	0.3168 mL	0.6337 mL	1.5842 mL
	50 mM	0.0507 mL	0.2535 mL	0.5070 mL	1.2674 mL
	60 mM	0.0422 mL	0.2112 mL	0.4225 mL	1.0562 mL

源叶