



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: LY-2562175
CAS 号: 1103500-20-4
产品货号: S87912

生物活性:

Description	LY2562175 是一种有效且有选择性的 FXR 激动剂, 其 EC50 值为 193 nM。				
IC50 & Target	EC50: 193 nM (FXR)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC50	193 nM	Agonist activity at human FXR transfected in HEK293 cells assessed as transcriptional activity by luciferase reporter gene assay	
In Vitro	LY2562175 在基于细胞的共转染试验中促进人 FXR 的转录激活, EC50 为 193 nM。与 GW4064 相比, LY2562175 促进从共激活因子 SRC-1 的核受体相互作用域募集肽, 相对 EC50 为 121 nM[1]。				
In Vivo	LY2562175 引起血清胆固醇和血清甘油三酯的剂量依赖性降低。在 10 mg/kg 的剂量下, LY2562175 的胆固醇降低比载体处理的动物低 80%, 而血清甘油三酯的降低比对照组低 76%。ED50 分别为 2 和 3.4 mg/kg。用 LY2562175 处理雌性 ZDF 大鼠导致禁食和非禁食状态下血浆甘油三酯的剂量依赖性降低。当与 BRL49653 以固定剂量组合给药时, LY2562175 进一步降低空腹和非空腹状态下血浆中的甘油三酯水平。脂蛋白的 FPLC 分级显示 LY2562175 处理导致该动物模型中的 vLDL-C 降低和 HDL-c 显著增加[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 62.5 mg/mL (115.65 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	1.8503 mL	9.2517 mL	18.5034 mL
		5 mM	0.3701 mL	1.8503 mL	3.7007 mL
		10 mM	0.1850 mL	0.9252 mL	1.8503 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Genin MJ, et al. Discovery of 6-(4-{[5-Cyclopropyl-3-(2,6-dichlorophenyl)isoxazol-4-yl]methoxy}piperidin-1-yl)-1-methyl-1H-indole-3-carboxylic Acid: A Novel FXR Agonist for the Treatment of Dyslipidemia. J Med Chem. 2015 Dec 24;58(24):9768-72.

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	1.8503 mL	9.2517 mL	18.5034 mL	46.2586 mL
	5 mM	0.3701 mL	1.8503 mL	3.7007 mL	9.2517 mL
	10 mM	0.1850 mL	0.9252 mL	1.8503 mL	4.6259 mL
	15 mM	0.1234 mL	0.6168 mL	1.2336 mL	3.0839 mL
	20 mM	0.0925 mL	0.4626 mL	0.9252 mL	2.3129 mL
	25 mM	0.0740 mL	0.3701 mL	0.7401 mL	1.8503 mL
	30 mM	0.0617 mL	0.3084 mL	0.6168 mL	1.5420 mL
	40 mM	0.0463 mL	0.2313 mL	0.4626 mL	1.1565 mL
	50 mM	0.0370 mL	0.1850 mL	0.3701 mL	0.9252 mL
	60 mM	0.0308 mL	0.1542 mL	0.3084 mL	0.7710 mL
	80 mM	0.0231 mL	0.1156 mL	0.2313 mL	0.5782 mL
	100 mM	0.0185 mL	0.0925 mL	0.1850 mL	0.4626 mL