



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: **CS-2878; LY2828360**

CAS 号: **1231220-79-3**

产品货号: **S87924**

生物活性:

Description	LY2828360 是一个作用缓慢但很有效的 G 蛋白偏倚的大麻素受体 2 (CB2) 激动剂, 能够抑制 cAMP 的积累并激活 ERK1/2 通路。			
IC50 & Target	CB2[1].			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CHO	EC ₅₀	> 100 μ M	Agonist activity at human CB1 receptor expressed in CHO cells assessed as effect on [35S]-GTPgammaS binding after 30 mins by scintillation counting
	CHO	EC ₅₀	20.1 nM	Agonist activity at human CB2 receptor expressed in CHO cells by [35S]-GTPgammaS binding assay
	Sf9	EC ₅₀	> 100000 nM	Agonist activity at human CB1 receptor expressed in Sf9 cells by [35S]-GTPgammaS binding assay
	Sf9	EC ₅₀	20 nM	Agonist activity at human CB2 receptor expressed in Sf9 membranes assessed as effect on [35S]-GTPgammaS binding after 30 mins by scintillation counting
In Vivo	在 WT 小鼠中, LY2828360 的急性全身给药以剂量依赖性方式抑制紫杉醇诱导的机械和冷异常性疼痛。LY2828360 对紫杉醇诱导的机械和冷超敏反应产生时间依赖性抑制, 并且相对于药物注射前水平, 异常性疼痛的抑制在注射后至少维持 4.5 小时。注射后 24 小时, 紫杉醇引起的机械异常性疼痛已恢复到药物注射前的超敏反应水平。LY2828360 处理后 72 小时, 冷异常性疼痛的残余抑制消失。LY2828360 之前的长期给药可阻断 WT 小鼠对吗啡抗痛觉过敏作用产生耐受性, 但 CB2KO 小鼠则不然。慢性 LY2828360 处理抑制紫杉醇诱导的 WT 小鼠机械和冷异常性疼痛, 但在 CB2KO 小鼠之前对吗啡具有耐受性[1].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 10 mg/mL (23.42 mM); 超声助溶 (<60°C); 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 mM	2.3422 mL	11.7112 mL
		5 mM	0.4684 mL	2.3422 mL
		10 mM	0.2342 mL	1.1711 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: ≥ 1 mg/mL (2.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 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: ≥ 1 mg/mL (2.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 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: ≥ 1 mg/mL (2.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 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 10.0 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]. Lin X, et al. Slowly Signaling G Protein-Biased CB2 Cannabinoid Receptor Agonist LY2828360 Suppresses Neuropathic Pain with Sustained Efficacy and Attenuates Morphine Tolerance and Dependence. Mol Pharmacol. 2018 Feb;93(2):49-62.
------	---

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	2.3422 mL	11.7112 mL	23.4225 mL	58.5562 mL
	5 mM	0.4684 mL	2.3422 mL	4.6845 mL	11.7112 mL
	10 mM	0.2342 mL	1.1711 mL	2.3422 mL	5.8556 mL
	15 mM	0.1561 mL	0.7807 mL	1.5615 mL	3.9037 mL
	20 mM	0.1171 mL	0.5856 mL	1.1711 mL	2.9278 mL