



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: shyysw@sina.com

产品名称: **CYM5442**
CAS 号: **1094042-01-9**
产品货号: **S88768**

生物活性:

Description	CYM5442 是一种有效的，高选择性和口服活性的 鞘氨醇 1-磷酸 (S1P1) 受体激动剂，EC50 为 1.35 nM。CYM5442 对 S1P2, S1P3, S1P4 和 S1P5 无活性。CYM5442 激活依赖 S1P1 的 p42/p44-MAPK 磷酸化。CYM5442 具有视网膜神经保护作用，并可轻松穿过中枢神经系统。				
IC50 & Target	EC50: 1.35 nM (Sphingosine 1-phosphate (S1P1) receptor)[1]				
In Vitro	CYM5442 (0.5 μM; 0-60 分钟; HEK293 细胞) 处理以时间依赖性方式刺激 P32-正磷酸盐标记细胞中的 S1P1 磷酸化[1]。				
	CYM5442 激活转染 S1P1 的 CHO-K1 细胞中的 S1P1 依赖性 p42/p44-MAPK 磷酸化，EC50 为 46 nM。当与 CYM5442 (EC50 为 67 nM) 孵育时，丙氨酸 R120 (R120A) 突变体仍然能够维持 p42/p44-MAPK 活性。CYM5442 在 E121A S1P1 细胞中对 p42/p44-MAPK 的激活具有浓度依赖性，平均 EC50 值为 134 nM[1]。				
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	HEK293 cells stably expressing S1P1 fused to GFP on the carboxy-terminus			
	Concentration:	0.5 μM			
	Incubation Time:	0 minutes, 2 minutes, 5 minutes, 10 minutes, 30 minutes, 60 minutes			
In Vivo	Result:	Stimulated S1P1 phosphorylation in a time-dependent manner.			
	CYM5442 (1 mg/kg; 腹腔内注射; 每天; 持续 5 天; 成年雄性白化病 Wistar 大鼠) 处理显示视觉诱发电位 (VEP) 的视觉功能得以保留。与赋形剂相比，经 CYM 处理的动物的视网膜神经纤维层 (RNFL) 明显更厚[2]。				
	Animal Model:	Adult male albino Wistar rats (8-10 weeks old; 180-230 g) infected ocular endothelin-1 (ET-1)[2]			
	Dosage:	1 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; daily; for 5 days			
	Result:	Visual evoked potentials (VEP) showed preserved visual function. Showed significantly higher retinal ganglion cells (RGCs) numbers.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 2.63 mg/mL (6.42 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	2.4421 mL	12.2106 mL	24.4212 mL
		5 mM	0.4884 mL	2.4421 mL	4.8842 mL
		10 mM	---	---	---
*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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。					
参考文献	[1]. Gonzalez-Cabrera PJ, et al. Full pharmacological efficacy of a novel S1P1 agonist that does not require S1P-like headgroup interactions. Mol Pharmacol. 2008 Nov;74(5):1308-18.				



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: shyysw@sina.com

[2]. Blanco R, et al. The S1P1 receptor-selective agonist CYM-5442 protects retinal ganglion cells in endothelin-1 induced retinal ganglion cell loss. Exp Eye Res. 2017 Nov;164:37-45.

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, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4421 mL	12.2106 mL	24.4212 mL	61.0530 mL
	5 mM	0.4884 mL	2.4421 mL	4.8842 mL	12.2106 mL



源叶