



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: **URB937**
CAS 号: **1357160-72-5**
产品货号: **S89041**

生物活性:				
Description	URB937 是口服有效的、外周限制的 FAAH 抑制剂, IC50 值为 26.8 nM, 可增加 anandamide 水平。URB937 不能影响脑内 FAAH 水平 (无法透过血脑屏障)。			
IC50 & Target	IC50: 26.8 nM (FAAH)[1]			
In Vitro	URB937 可被 ATP 结合盒 (ABC) 膜转运蛋白 Abcg2 主动从中枢神经系统 (CNS) 外排[3]。			
In Vivo	URB937 (1 mg/kg, 腹腔注射) 在小鼠中增加外周组织中的内源性大麻素 Anandamide 水平, 但不影响前脑或下丘脑中的水平[1]。			
	URB937 (1 mg/kg, 皮下注射) 能够抑制由腹腔注射醋酸引起的小鼠疼痛反应[1]。			
	在雄性大鼠中, URB937 (口服剂量 3 mg/kg, 生物利用度 F = 36%) 以中等速率吸收, 并在一小时 后达到血浆峰值浓度 (Cmax) 为 159.47 ng/ml。URB937 的半衰期(T1/2)为 60 分钟, 当口服剂量为 3 mg/kg 时[2]。			
	URB937 在雌性小鼠和大鼠的内脏和炎症疼痛模型中产生了高度的镇痛效果。此外, 该化合物在 怀孕的小鼠和大鼠中对胎盘和胎儿组织的渗透有限[3]。			
	URB937 (1 mg/kg, 每两天一次, 持续 30 天) 减轻了辐射引起的肺损伤, 并增加了肺组织中的内 源性大麻素浓度[4]。			
	Animal Model:	Swiss Webster mice[1].		
	Dosage:	1 mg/kg.		
	Administration:	S.C.		
	Result:	Suppressed pain responses elicited by i.p. injections of acetic acid.		
	Animal Model:	Adult Sprague Dawley male and female rats (250-300 g)[2].		
Dosage:	0.3, 1, 3, 10 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis).			
Administration:	Single oral dose.			
Result:	Inhibited liver FAAH activity with a median effective dose (ED ₅₀) of 0.9 mg/kg.			
	Inhibits FAAH in peripheral tissues and identify a possible biomarker for target engagement.			
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (282.17 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用 新开封的 DMSO)			
	* "≥" means soluble, but saturation unknown			
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.8217 mL	14.1084 mL	28.2167 mL
	5 mM	0.5643 mL	2.8217 mL	5.6433 mL
	10 mM	0.2822 mL	1.4108 mL	2.8217 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, 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。				
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 (7.05 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 (7.05 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 (7.05 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]. Jason R Clapper, et al. Anandamide suppresses pain initiation through a peripheral endocannabinoid mechanism. Nat Neurosci. 2010 Oct;13(10):1265-70. [2]. Valentina Vozella, et al. Pharmacokinetics, pharmacodynamics and safety studies on URB937, a peripherally restricted fatty acid amide hydrolase (FAAH) inhibitor, in rats. J Pharm Pharmacol. 2019 Dec;71(12):1762-1773. [3]. G Moreno-Sanz, et al. Pharmacological characterization of the peripheral FAAH inhibitor URB937 in female rodents: interaction with the Abcg2 transporter in the blood-placenta barrier. Br J Pharmacol. 2012 Dec;167(8):1620-8. [4]. Rui Li, et al. The Fatty Acid Amide Hydrolase Inhibitor URB937 Ameliorates Radiation-Induced Lung Injury in a Mouse Model. Inflammation. 2017 Aug;40(4):1254-1263.
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℃, 6 months; -20℃, 1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。	



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	2.8217 mL	14.1084 mL	28.2167 mL	70.5418 mL
	5 mM	0.5643 mL	2.8217 mL	5.6433 mL	14.1084 mL
	10 mM	0.2822 mL	1.4108 mL	2.8217 mL	7.0542 mL
	15 mM	0.1881 mL	0.9406 mL	1.8811 mL	4.7028 mL
	20 mM	0.1411 mL	0.7054 mL	1.4108 mL	3.5271 mL
	25 mM	0.1129 mL	0.5643 mL	1.1287 mL	2.8217 mL
	30 mM	0.0941 mL	0.4703 mL	0.9406 mL	2.3514 mL
	40 mM	0.0705 mL	0.3527 mL	0.7054 mL	1.7635 mL
	50 mM	0.0564 mL	0.2822 mL	0.5643 mL	1.4108 mL
	60 mM	0.0470 mL	0.2351 mL	0.4703 mL	1.1757 mL
	80 mM	0.0353 mL	0.1764 mL	0.3527 mL	0.8818 mL
	100 mM	0.0282 mL	0.1411 mL	0.2822 mL	0.7054 mL

源叶