Catalog Number: CM04967

产品信息

Catalog Number:
CM04967

CAS号:
565460-15-3

分子式:
C₁₉H₂₁NO₂

主要靶点:
Antibacterial|Lipase

主要通路:
代谢|微生物学

分子量:
295.38

溶解度:
DMSO:55 mg/mL (186.2 mM)

靶点活性

MGL:28±4 μM

体外活性

MGL对2-AG的表现Km值为24±1.7 μM，其Vmax为1814±51 nmol/min/mg蛋白；在URB602作用下，Km值为20±0.4 μM，Vmax为541±20 nmol/min/mg蛋白（n=4）。将大鼠前脑的器官型切片培养体与URB602（100 μM）一同孵育时，基线以及Ca²⁺-离子载体刺激下的2-花生四烯酰基甘油（2-AG）浓度均有所增加[1]。URB602通过快速且非竞争性机制抑制重组MGL（IC₅₀: 223±63 μM）。

体内活性

URB602（20-40 mg/kg）能减缓上消化道传输速度和降低结肠推进力。在全肠道传输实验中，URB602剂量依赖性抑制传输速率（P<0.05），与对照组相比有显著差异。然而，在特定小鼠中，40 mg/kg的URB602对全肠道传输的抑制作用消失，这表明CB₁受体在其抑制作用中起着重要作用[3]。在福尔马林试验的早期阶段，URB602减少了成年雄性斯普拉格-道利大鼠JZL184（ED₅₀: 0.06±0.028 μg）和URB602（ED₅₀: 120±51.3 μg）的疼痛行为面积下曲线（AUC）。同时，两种MGL抑制剂在福尔马林疼痛的晚期也能抑制疼痛行为，分别为JZL184（ED₅₀: 0.03±0.011 μg）和URB602（ED₅₀: 66±23.9 μg）。

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.