产品名称：GW842166X
产品别名：GW842166X

生物活性：

Description	GW842166X is a potent and selective cannabinoid receptor 2 (CB2) agonist with IC_{50} values of 63 and 91 nM for human and rat CB2, respectively.
IC_{50} & Target	IC50: 63 nM (human CB2), 91 nM (rat CB2)[1]
In Vitro	GW842166X shows similar potency and efficacy for rat and human recombinant CB2 receptors. It has no significant agonist activity at concentrations up to 30 μM in human and rat CB1 recombinant assays[1].
In Vivo	GW842166X has an oral ED50 of 0.1 mg/kg in the rat FCA model of inflammatory pain and shows full reversal of hyperalgesia at 0.3 mg/kg. The blood concentrations of GW842166X in experiments are 30 nM (0.03 mg/kg), 130 nM (0.1 mg/kg), and 370 nM (0.3 mg/ kg) 1 h after dosing. After dosing for 4 days in the FCA model, no statistical difference in antihyperalgesic response is observed on day 4 relative to day 1, indicating that tolerance does not occur[1].

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 83.3 mg/mL (185.42 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	2.2259 mL	11.1297 mL	22.2593 mL
	5 mM	0.4452 mL	2.2259 mL	4.4519 mL
	10 mM	0.2226 mL	1.1130 mL	2.2259 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: 2.5 mg/mL (5.56 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

此方案可获得 2.5 mg/mL (5.56 mM)的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。

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；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.56 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.56 mM，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。

	3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.56 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.56 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 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。
References	[1]. Giblin GM, et al. Discovery of 2-[(2,4-dichlorophenyl)amino]-N-[(tetrahydro-2H-pyran-4-yl)methyl]-4-(trifluoromethyl)- 5-pyrimidinecarboxamide, a selective CB2 receptor agonist for the treatment of inflammatory pain. J Med Chem. 2007 May 31;50(11):2597-600.