

## SR1664

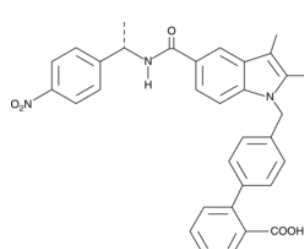
产品编号：MB0591

质量标准：>98%,BR

包装规格：1MG

产品形式：白色至米色粉末

### 基本信息

|              |                                                   |             |                                                                                     |
|--------------|---------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 分子式          | C33H29N3O5                                        | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量          | 547.6                                             |             |                                                                                     |
| CAS No.      | 1338259-05-4                                      |             |                                                                                     |
| 储存条件         | -20℃，避光防潮密闭干燥                                     |             |                                                                                     |
| 溶解性<br>(25℃) | DMSO: 15 mg/mL<br>Ethanol 15mg/mL<br>DMF 20 mg/mL |             |                                                                                     |
| 注意事项         | 溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。                     |             |                                                                                     |
| 其他说明         | 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。                         |             |                                                                                     |

**简介：**SR1664 是一种非激动剂 PPAR $\gamma$ 配体，是 CDK5 介导的 PPAR $\gamma$ 磷酸化的抑制剂。

### 别名：

4'-[[[2,3-dimethyl-5-[[[(1S)-1-(4-nitrophenyl)ethyl]amino]carbonyl]-1H-indol-1-yl]methyl]-[1,1'-biphenyl]-2-carboxylic acid

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

UV  $\lambda_{max}$ ：.....252 nm

溶解性：.....DMSO: 15 mg/mL；Ethanol 15mg/mL；DMF 20 mg/mL

纯度：.....>98%,BR

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性及研究进展

近日，美国研究人员研发出一种能用于治疗 Diabetes 的新型化合物，与现有药物相比，它能改善血糖水平，却没有相关副作用。美国斯克里普斯研究所等机构的研究人员报告说，这种新型化合物名为 **SR1664**，作用原理是通过干扰某些蛋白质的功能来帮助治疗 Diabetes。研究人员用 **SR1664** 和现有降糖药物文迪雅分别治疗患有 Diabetes 的实验鼠，结果显示两者都能改善实验鼠的血糖水平，但文迪雅有使实验鼠体重增加等副作用，新的化合物则没有相关副作用。此外，实验室细胞培养研究还显示，该化合物也不存在文迪雅等降糖药物影响骨骼的副作用。文迪雅曾是流行的 Diabetes 药物，但近来发现其副作用明显，美国等一些国家已下令将其全面下架。因此，寻找新的无副作用的 Diabetes 药物成了研究热点。**SR1664** 的作用目标是那些已知的 Diabetes 治疗靶点，但其发挥作用的机制独特，因此既有治疗功能又没有某些副作用。

**SR1664** 是一种非激动剂 PPAR $\gamma$ 配体，是 CDK5 介导的 PPAR $\gamma$ 磷酸化的抑制剂。它在两种 Diabetes 小鼠模型中具有很强的抗 Diabetes 活性，而没有副作用与噻唑烷二酮（TZD）抗 DiabetesPPAR $\gamma$ 激动剂结合。TZD 抗 Diabetes 药物如罗格列酮和吡格列酮是完整的 PPAR $\gamma$ 激动剂，但最近的数据表明它们的单独活性，通过 CDK5 抑制肥胖相关的 PPAR $\gamma$ 磷酸化，可能是抗 Diabetes 作用的更重要的活性。SR1664 在竞争结合试验中具有 80

nm 的 IC50，阻断了 CDK5 介导的 PPAR $\gamma$  在体外的磷酸化，在 20 和 200 nm 之间的 IC50，并且没有 PPAR $\gamma$  激动剂活性。

#### 美仑相关产品推荐

|        |                       |
|--------|-----------------------|
| MB1780 | SR12813               |
| MB0264 | SR3677                |
| MB5023 | 2-氯-5-硝基苯甲酰苯胺;GW 9662 |
| MB3813 | GSK3787               |
| MB3709 | GW0742                |
| MB7303 | GW501516              |
| MB4844 | L-165041              |
| MB3812 | T0070907              |

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。**SR1664** 是一种非激动剂 PPAR $\gamma$  配体，是 CDK5 介导的 PPAR $\gamma$  磷酸化的抑制剂。SR1664 的作用目标是那些已知的 Diabetes 治疗靶点，但其发挥作用的机制独特，因此既有治疗功能又没有某些副作用。可以作为治疗糖尿病相关科学研究。

#### 【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

## 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

| 物种 | 体重(KG) | 体表面积(M2) | Km 系数 |
|----|--------|----------|-------|
| 狒狒 | 12     | 0.6      | 20    |
| 狗  | 10     | 0.5      | 20    |
| 猴  | 3      | 0.24     | 12    |
| 兔  | 1.8    | 0.15     | 12    |
| 豚鼠 | 0.4    | 0.05     | 8     |
| 大鼠 | 0.15   | 0.025    | 6     |
| 仓鼠 | 0.08   | 0.02     | 5     |
| 小鼠 | 0.02   | 0.007    | 3     |

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

| 标示重量范围   | 误差范围  |
|----------|-------|
| 1-20MG   | 0.1MG |
| 50-500MG | 1MG   |
| >1G      | 3-5MG |

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。