

## GW0742

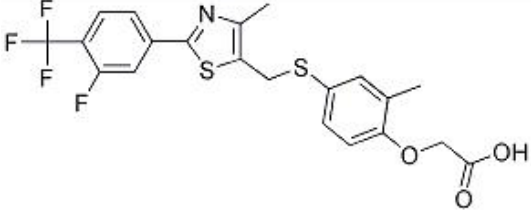
产品编号: MB3709

质量标准: >98%, 选择性 PPAR $\beta/\delta$ 激动剂

包装规格: 5MG; 25MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C21H17F4NO3S2	结 构 式	
分子量	471.49		
CAS No.	317318-84-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 94 mg/mL (199.37 mM) Ethanol 44 mg/mL (93.32 mM) Water Insoluble		
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:** GW0742 是一种有效的, 选择性 PPAR $\beta/\delta$ 激动剂, IC<sub>50</sub> 为 1 nM, 比作用于 hPPAR $\alpha$ 和 hPPAR $\gamma$  选择性高 1000 倍。

**别名:** Acetic acid, 2-[4-[[[2-[3-fluoro-4-(trifluoromethyl)phenyl]-4-methyl-5-thiazolyl]methyl]thio]-2-methylphenoxy]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色或类白色粉末

溶解性: .....DMSO 94 mg/mL (199.37 mM);Ethanol 44 mg/mL (93.32 mM);Water Insoluble

含量: .....>98%

**储存条件:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	GW0742 是一种有效的, 选择性 PPAR $\beta/\delta$ 激动剂, IC <sub>50</sub> 为 1 nM, 比作用于 hPPAR $\alpha$ 和 hPPAR $\gamma$ 选择性高 1000 倍。
特性	GW0742 和 L-165041 都激活血小板中的 PPAR $\beta$ , 而不是 PPAR $\gamma$ 或 PPAR $\alpha$ 。
靶点	PPAR $\delta$

	1 nM(EC50)
体外研究	在细胞基本转录实验中, GW0742 有效作用于 hPPAR $\alpha$ , hPPAR $\gamma$ , 和 hPPAR $\delta$ . EC50 分别为 1.1 $\mu$ M, 2 $\mu$ M 和 1 nM. GW0742 (0.2 $\mu$ M 和 1 $\mu$ M)作用于 N/TERT-1 角质形成细胞, 显著增加 PPAR $\beta/\delta$ 的活性. GW0742 (1 $\mu$ M)显著抑制 N/TERT-1 角质形成细胞的平均细胞数. GW0742 (1 $\mu$ M)提高 G1 期细胞数, 降低 S 期细胞数. GW0742 (1 $\mu$ M)作用于 N/TERT-1 角质形成细胞及小鼠原代角质形成细胞, 显著增加 mRNA 编码的 ADRP, 一种 PPAR $\beta/\delta$ 的靶基因. GW0742 (1 $\mu$ M) 作用于 N/TERT-1 细胞, 显著降低视网膜母细胞瘤(Rb)的磷酸化, 也显著降低 p42/44 ERK 的水平. 100 $\mu$ M GW0742 作用于小脑颗粒神经元, 显著降低低 KCl 诱导的神经元细胞死亡. 通过测量 LDH 释放, 观察到 100 $\mu$ M GW0742 显著增强细胞死亡. 100 $\mu$ M GW0742 处理小脑颗粒神经元培养基 6 小时, 显著增强 c-Jun 的表达. 100 $\mu$ M GW0742 作用于 MCF-7 细胞, 在 1.5% BSA 存在时, 增加 PPAR $\alpha$ 介导的转录.
体内研究	GW0742 (10 mg/kg)处理 C57BL6/J 小鼠, 促进胆固醇逆向转运. GW0742 (10 mg/kg)处理 C57BL6/J 小鼠, 促进高密度脂蛋白胆固醇的粪便排泄, 尽管对高密度脂蛋白胆固醇代谢没有影响. GW0742 作用于小鼠的小肠, 降低 NPC1L1mRNA 的表达. GW0742 (30 mg/kg)处理雄性 BALB/c 小鼠, 在诱导 LPS-介导的肺部炎症之前, 显著降低白细胞募集到肺空间. GW0742 (30 mg/kg)处理小鼠支气管肺泡灌洗液, 显著降低促炎性细胞因子 IL-6, IL-1 $\beta$ 和 TNF- $\alpha$ 的蛋白和 mRNA 水平.

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB7303	GW501516
--------	----------

**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. GW0742 是一种有效的, 选择性 PPAR $\beta/\delta$ 激动剂,本品可用于相关领域科研实验。

#### 储液配置

浓度	DMSO 质量		
	体	积	量
1 mg	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1209 mL	10.6047 mL	21.2094 mL
5 mM	0.4242 mL	2.1209 mL	4.2419 mL
10 mM	0.2121 mL	1.0605 mL	2.1209 mL
50 mM	0.0424 mL	0.2121 mL	0.4242 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p><b>Cell lines:</b> N/TERT-1 角质形成细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 1 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 6 天</p> <p><b>Method:</b> N/TERT-1 角质形成细胞按每孔 <math>3 \times 10^4</math> 个细胞接种在 6 孔组织培养皿中, 孔中含 Ker-SFM 培养基. 24 小时后, 使用 Z1 Coulter 颗粒计数器测量细胞数, 用来测定出菌率 (实验第 0 天). 对于剩余的细胞, 改变培养基为 Ker-SFM/DF-K, 细胞按一式三份分别使用 0.1% DMSO, 0.1 <math>\mu</math>M 或 1 <math>\mu</math>M GW0742 处理. 每天测定一次细胞数, 使用新鲜培养基处理剩余的细胞, 持续处</p>
------	---

	理 6 天。
动物实验	<b>Animal Models:</b> 野生型 C57BL/6 雌性小鼠 <b>Formulation:</b> 生理盐水 <b>Dosages:</b> 10 mg/kg <b>Administration:</b> 补充饲料

**【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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，请选择用合适溶剂，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在200转左右稍作离心，管底收集液体，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。