

GW-9508 ; GW9508

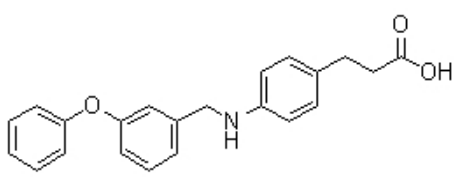
产品编号 : MB3819

质量标准 : >98%,选择性 FFA1(GPR40)激动剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H21NO3	结 构 式	
分子量	347.41		
CAS No.	885101-89-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 69 mg/mL (198.61 mM) Water Insoluble Ethanol : 69 mg/mL (198.61 mM)		
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 : GW9508 是 FFA1 (GPR40) 激动剂, pEC50 为 7.32, 比对 GPR120 的抑制性高 100 倍, 可通过葡萄糖敏感的方式刺激胰岛素分泌。

别名 : 4-(3-Phenoxybenzylamino)phenylpropionic acid

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 69 mg/mL (198.61 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 69 mg/mL (198.61 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	GW9508 是一种有效的, 选择性 FFA1(GPR40)激动剂, pEC50 为 7.32, 比作用于 GPR120 选择性高 100 倍, 以葡萄糖敏感性方式刺激胰岛素的分泌。					
特性	GW1100 可逆转 GW9508 对胰岛素分泌的影响, 而 GW1100 可部分降低亚油酸刺激的胰岛素分泌。					
靶点	<table border="1"> <tr> <td>GPR40</td> <td>GPR120</td> </tr> <tr> <td>7.32(pEC50)</td> <td>5.46(pEC50)</td> </tr> </table>	GPR40	GPR120	7.32(pEC50)	5.46(pEC50)	
GPR40	GPR120					
7.32(pEC50)	5.46(pEC50)					
体外研究	GW9508 作用于 220 种其他 GPCRs, 60 种激酶, 63 种蛋白酶, 7 种整合素, 及 20 种核受体, 包括 PPAR α , δ 和 γ (pEC50 分别为 4.0, 4 和 4.9) 选择性至少为 100 倍。GW9508 通过激活 GPR40 受体与 GPR120 受体而增加细胞内 Ca ²⁺ 浓度, 这种在作用存在浓度依赖性。GW9508 是有效的 GPR40 和 GPR120 激动剂, 作用于 GPR40 比作用于 GPR120 选择性高 100 倍。在高血糖水平时(25 mM), GW9508 提高葡萄糖刺激的胰岛素分泌(pEC50=6.14) ,					

这种作用存在浓度依赖性。GW9508 作用于 MIN6 细胞,按葡萄糖敏感性刺激胰岛素的分泌,这种作用存在剂量依赖性。此外, GW9508 作用于 MIN6 细胞,还增强 KCl 介导的胰岛素分泌增加。GW9508 作用于大鼠 β -细胞,诱导超极化和 K_{ATP} 通道开放。GW9508 抑制 CCL17 和 CCL5 表达,这种作用存在 Pertussis toxin 敏感性。GW9508 作用于 HaCaT 细胞,进一步抑制 TNF- α 和 IFN- γ 诱导的 IL-11, IL-24, 和 IL-33 表达。GW9508 也通过正常人类表皮角质形成细胞抑制 CCL5 和 CXCL10 产生。

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)

MB2436	DC260126
MB8801	GW1100
MB3819	GW9508
MB5715	TAK875

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。本品 GW9508 是一种选择性的 FFA1/GPR40 激动剂, 可用来鉴别和表征游离脂肪酸受体 FFA1/GPR40。GW9508 用于研究 FFA1/GPR40 受体在糖刺激胰岛素释放的游离脂肪酸增强和 2 型糖尿病过程中的作用。有研究采用 GW9508 研究 FFA1/GPR40 受体通过抑制破骨细胞分化, 抑制完全 Freund s 佐剂(CFA)诱导的炎症性慢性疼痛, 在体内保护卵巢切除诱导的骨丢失的过程。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8784 mL	14.3922 mL	28.7844 mL
5 mM	0.5757 mL	2.8784 mL	5.7569 mL
10 mM	0.2878 mL	1.4392 mL	2.8784 mL
50 mM	0.0576 mL	0.2878 mL	0.5757 mL

【注意】

- 我公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, 否则会影晌化合物活性, 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成了误差,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。