

## GW9662 ; 2-氯-5-硝基苯甲酰苯胺 ; GW 9662

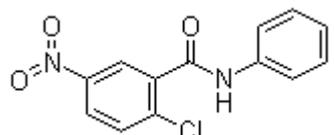
产品编号 : MB5023

质量标准 : >98% , 选择性 PPAR 拮抗剂

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C13H9ClN2O3	结 构 式	
分子量	276.68		
CAS No.	22978-25-2		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 55 mg/mL (198.78 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol 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 :** GW9662 是有效, 选择性的 PPAR $\gamma$  拮抗剂, 比 PPAR $\alpha$ 和 PPAR $\delta$ 的选择性高 10 倍和 600 倍。

**别名 :** Benzamide, 2-chloro-5-nitro-N-phenyl

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 55 mg/mL (198.78 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	GW9662 是一种选择性 PPAR 拮抗剂, 作用于 PPAR $\gamma$ , 无细胞试验中 IC50 为 3.3 nM, 在细胞中作用于 PPAR $\gamma$ 比作用于 PPAR $\alpha$ 和 PPAR $\delta$ 的功能选择性强 10 到 600 倍。	
<b>靶点</b>	PPAR $\gamma$ (Cell-free assay)	PPAR $\alpha$ (Cell-free assay)
	3.3 nM	32 nM

<b>体外研究</b>	GW9662 在 PPAR $\gamma$ 上结合 Cys(285), PPAR $\gamma$ 是三种 PPAR 中保守的。GW9662 是 PPAR $\gamma$ 拮抗剂, 用于抑制脂肪细胞分化。GW9662 抑制 PPAR $\gamma$ 激活, 且抑制人乳腺癌肿瘤细胞系 (MCF7, MDA-MB-468, MDA-MB-231) 生长, IC50 为 20 $\mu$ M-30 $\mu$ M, 说明 GW9662 的 PPAR $\gamma$ 激动剂性能或 PPAR $\gamma$ 非依赖性生长抑制机制。Rosiglitazone(50 $\mu$ M)与 GW9662(10 $\mu$ M)联用, 作用于 MDA-MB-231 细胞, 7 天后, 统计学上产生较低的存活细胞数。在原代鼠骨髓 (BMs) 和 RAW264.7 细胞中, PPAR $\gamma$ 1 配体能够抑制 RANKL 诱导的破骨细胞形成。重要的是, GW 9662(2 $\mu$ M)可逆转这些配体的抑制作用, 存在浓度依赖性。GW 9662(2 $\mu$ M)作用于 BMs, 阻断 IL-4 对破骨细胞形成的抑制。GW 9662(1 $\mu$ M) 作用于 RAW264.7 细胞, 抑制 NF- $\kappa$ B 的 RANKL 激活。GW9662(10 $\mu$ M)作用于甲状腺眼病患者的原代前脂肪细胞, 抑制激素和激动剂诱导的脂肪细胞分化。
<b>体内研究</b>	LPS(1 mg/kg, 腹腔注射)预处理大鼠, 显著减弱肾损伤和功能障碍引起的缺血/再灌注 (I/R) 损伤的所有标记。最值得注意的是, GW9662(1 mg/kg, 腹腔注射), 可废除 LPS 的保护作用。

**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)**

MB3812	T0070907
MB3709	GW0742
MB7303	GW501516
MB4844	L-165041

**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 GW9662 是有效, 选择性的 PPAR $\gamma$  拮抗剂, 可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.6143 mL	18.0714 mL	36.1428 mL
5 mM	0.7229 mL	3.6143 mL	7.2286 mL
10 mM	0.3614 mL	1.8071 mL	3.6143 mL
50 mM	0.0723 mL	0.3614 mL	0.7229 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验:</b>	结合实验: 人 PPAR $\alpha$ , PPAR $\gamma$ , 和 PPAR $\delta$ 配体结合域 (LBDs) 在 E. coli 中表达, 作为聚组氨酸标记的
--------------	--

	<p>融合蛋白。在实验缓冲液中，通过加入所需受体(15 nM)到链霉亲和素修饰的 SPA 珠(0.5 mg/mL)浆中，使受体固定在 SPA 珠上。混合物在室温下平衡至少 1 小时，然后在 1×10<sup>3</sup>g 转速下将珠粒沉淀。除去上清液，轻轻混合，珠粒再悬浮于新鲜的实验缓冲液。重复离心/重悬浮步骤被，立即使用所得的受体包被的珠浆液，或贮存于 4°C 下长达 1 周再使用。使用 [3H]GW2443 作为放射性配体，分别测定与 PPAR<math>\alpha</math>，PPAR<math>\gamma</math>，PPAR<math>\delta</math> 的竞争性结合。除非另有说明，所有实验缓冲液为 50 mM HEPES (pH 7)，50 mM NaCl，5 mM CHAPS，0.1 mg/mL BSA，和 10 mM DTT。一些实验中，使用 50 mM Tris (pH 8) 替换 HEPES (pH 7)。</p>
<p><b>细胞实验：</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> MDA-MB-231 细胞 <b>Concentrations:</b> 10 <math>\mu</math>M <b>Incubation Time:</b> 10 天 <b>Method:</b> MDA-MB-231 按 1×10<sup>5</sup> 细胞/25 cm<sup>3</sup> 组织培养瓶的密度接种。24 小时后(第 0 天)，使用含 Rosiglitazone (50 <math>\mu</math>M)，GW9662 (10 <math>\mu</math>M) 或两者都有的新鲜培养基置换生长培养基。对照烧瓶中为 0.1% DMSO。通过胰酶消化，收集第 0, 3, 5, 7, 10 天的每种处理条件的细胞，使用台盼蓝染色，使用血球仪计算每瓶细胞总数和存活细胞数。</p>
<p><b>动物实验：</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> 雄性 Wistar 大鼠 <b>Formulation:</b> 10% (v/v) DMSO <b>Dosages:</b> 1 mg/kg <b>Administration:</b> 腹腔注射</p>

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。