

TAK-875 ; TAK875

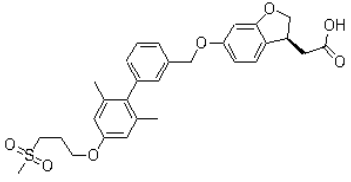
产品编号 : MB5715

质量标准 : >98%,GPR40 激动剂

包装规格 : 5MG;10MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C29H32O7S	结构式	
分子量	524.63		
CAS No.	1000413-72-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL (187.39 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 : Fasiglifam (TAK-875) 是一种有效的, 可口服的, 具有选择性的 GPR40 激动剂。**别名 :** TAK-875 ; 3-Benzofuranacetic acid, 6-[[2',6'-dimethyl-4'-[3-(methylsulfonyl)propoxy][1,1'-biphenyl]-3-yl]methoxy]-2,3-dihydro-, (3S)-**物理性状及指标 :**

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO 100 mg/mL (187.39 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**

产品描述	Fasiglifam (TAK-875)是一种选择性 GPR40 激动剂, 在表达人 GPR40 的 CHO 细胞系中 EC50 为 14 nM, 比油酸有效 400 倍。
特性	能够比油酸更有效地激活 hGPR40。
靶点	GPR40

	(CHO cells expressing human GPR40) 14 nM(EC50)
体外研究	TAK-875 表现出有效的激动剂活性, 并对人 GPR40 受体表现出高结合亲和力, K_i 为 38 nM。TAK-875 对大鼠 GPR40 受体表现出较弱的亲和力, K_i 为 140 nM。TAK-875 表现出良好的选择性, 其对 FFA 受体家族的其他成员几乎没有激动作用, $EC_{50} > 10 \mu M$ 。TAK-875 治疗诱导 CHO-hGPR40 中细胞内 IP 的产生浓度依赖性增加, EC_{50} 为 72 nM, 比需要更高配体浓度以激活受体的内源性配体的激动剂油酸(EC_{50} 为 29.9 μM)更有效。在 hGPR40 缺失的对照组 CHO 细胞中, 无论是 TAK-875 或是油酸, 都不能诱发 IP 应答。与 $Gq\alpha$ 介导的信号通路激活一致, TAK-875 增加胰岛 β 细胞中葡萄糖依赖性胰岛素分泌。TAK-875 对 GPR40/FFA1 延长的刺激不会引起胰岛 β 细胞功能障碍或诱导细胞凋亡。
体内研究	在糖尿病大鼠模型中, TAK-875 以 0.3-3 mg/kg 单剂量口服给药降低血糖波动, 并且口服葡萄糖刺激 1 小时之前, TAK-875 给药能够增加口服葡萄糖耐量试验中的胰岛素分泌。在 2 型糖尿病 N-STZ-1.5 大鼠体内, TAK-875(1-10 mg/kg p.o.)给药明显提高葡萄糖耐受性, 并增加胰岛素分泌。此外, 在雄性 Zucker 糖尿病肥胖大鼠体内, TAK-875 (10 mg/kg, p.o.)显著增加血浆胰岛素水平, 并降低空腹高血糖, 然而在禁食的正常 Sprague-Dawley 大鼠体内, TAK-875 即使在 30 mg/kg 剂量, 也不增强胰岛素分泌, 且不会引起低血糖。

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

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 Fasiglifam (TAK-875) 是一种有效的, 可口服的, 具有选择性的 GPR40 激动剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9061 mL	9.5305mL	19.0610 mL
5 mM	0.3812 mL	1.9061 mL	3.8122 mL
10 mM	0.1906 mL	0.9530 mL	1.9061 mL

50 mM	0.0381 mL	0.1906 mL	0.3812 mL
-------	-----------	-----------	-----------

经典实验操作 (来自文献, 仅供参考)

动物实验	<p>Animal Models: 接受口服葡萄糖耐量试验的雌性 Wistar 肥胖大鼠</p> <p>Formulation: 在 0.5% 甲基纤维素中配制</p> <p>Dosages: ~3 mg/kg</p> <p>Administration: 口服</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
狻狻	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。