

**GW1100 ; GW-1100 ; GW 1100**

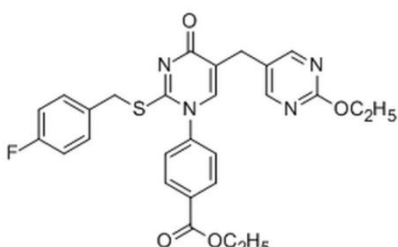
产品编号：MB8801

质量标准：&gt;98%,GPR40 拮抗剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：白色粉末

**基本信息**

分子式	C27H25FN4O4S	结 构 式	
分子量	520.58		
CAS No.	306974-70-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	10 mM in DMSO		
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：**GW-1100 是一种选择性的 GPR40 拮抗剂，pIC<sub>50</sub> 为 6.9，GW1100 也用作 GPR40 反向激动剂。

**别名：**

1-(4-Ethoxycarbonylphenyl)-2-(4-fluorobenzylthio)-5-(2-ethoxy-5-pyrimidinylmethyl)-4-pyrimidinone, SB376752

**物理性状及指标：**

外观：.....白色粉末

溶解性：.....10 mM in DMSO

纯度：.....&gt;98%，GPR40 拮抗剂

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

**生物活性：**

2 型糖尿病约占糖尿病总病例数的 90%，目前研发的其新型治疗药物主要是通过调节糖代谢通路来控制血糖水平，它们可通过激活 G 蛋白偶联受体尤其是 G 蛋白偶联受体 40，增强胰岛β 细胞功能，促进胰岛素分泌，提高机体对胰岛素的敏感性，从而达到治疗糖尿病的目的。G 蛋白偶联受体 40 作为抗 2 型糖尿病的新靶点，以其潜在优势，在糖尿病治疗领域备受关注。**GW-1100** 是一种选择性的 GPR40 拮抗剂，GW1100 也用作 GPR40 反向激动剂。可用于治疗 2 型糖尿病的相关科研。

<b>产品描述</b>	GW-1100 是一种选择性的 GPR40 拮抗剂，其 pIC <sub>50</sub> 为 6.9。GW1100 是一种 GPR40 反向激动剂。
<b>靶点&amp;IC50</b>	pIC <sub>50</sub> : 6.9 (GPR40)
<b>体外研究</b>	GW1100 剂量依赖性抑制 gpr40 介导的 Ca <sup>2+</sup> 升高 受 GW9508 和亚油酸的刺激(pIC <sub>50</sub> 值分别为 5.99 0.03 和 5.99 0.06)。GW-1100 的浓度 1μM 产生 GW9508 量效曲线显著右转(pEC <sub>50</sub> = 7.17 - 0.08 没有和 pEC <sub>50</sub> = 6.79 - 0.09 的 1μM GW-1100; P < 0.05; n = 3)。3μM GW-1100 的浓度和更高的显著降低最大反应是观察继续向右转变 pEC <sub>50</sub> 反应。g -1100 (GW1100)可在 chol - k1 /bFFAR1 细胞和中性粒细胞中减少 FFAR1 配体诱导

	的细胞内钙。CHO-K1 / bFFAR1 细胞孵化 15 分钟 10 $\mu$ M GW1100 或车辆(0.1% DMSO) 然后刺激与车辆,油酸,亚油酸或 GW9508。gw1 -1100 显著降低了 300 M 油酸 (AUC(60-150 s)、p<0.05)、100 M 亚油酸(AUC(60-150 s)、p<0.05)和 10 M GW9508 (AUC(60-150 s)、p<0.05)的细胞内钙的增加。
<b>体内研究</b>	脑内注射 DHA (50 g)和 GW9508 (1.0 g), 一种 gpr40 -选择性激动剂, 在第 7 天显著降低机械异常和热痛觉, 但在 CFA 注射后第 1 天没有。GPR40 拮抗剂 gw -1100 (10 g) 可抑制脑室前处理。

**美仑相关产品推荐**

MB3819	GW9508	GW9508
MB2434	AMG 837	AMG 837 calcium hydrate
MB2435	TUG-770	TUG770
MB2436	DC260126	DC-260126
MB8801	GW1100	GW-1100
MB3818	TAK875	TAK-875 hemihydrate
MB1342	格列吡嗪	Glipizide
MB1564	格列美脲	Glimepiride
MB1564-S	格列美脲(标准品)	Glimepiride
MB1956	Nateglinide	那格列奈
MB2048	米格列奈钙	Mitiglinide calcium Hydrate

**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。**GW-1100** 是一种选择性的 GPR40 拮抗剂, GW1100 也用作 GPR40 反向激动剂。可用于治疗 2 型糖尿病的相关科研。

**储液配置**

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9209 mL	9.6047 mL
5 mM	0.3842 mL	1.9209 mL	3.8419 mL	
10 mM	0.1921 mL	0.9605 mL	1.9209 mL	

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	GW1100 (GW1100)是在 DMSO 中制备的, 然后用适当的培养基(DMSO - 0.1%)稀释后再使用。CHO-K1 / bFFAR1 或 CHO-K1 / pcDNA3.1 细胞(2 10 <sup>6</sup> 个细胞/ 2 毫升)含有 2.5 $\mu$ M Fura-2AM 荧光指示剂染料在记录缓冲区(10 毫米玫瑰,140 毫米氯化钠,2 毫米氯化钙,21 毫米 MgCl <sub>2</sub> ,25 毫米氯化钾,10 毫米葡萄糖,pH 值 7.4)30 分钟,洗了三次,记录缓冲区,并返回 10 分钟。细胞的孵化器孵化与不同浓度的丙酸(1、10 和 30 毫米),油酸(0 - 500 $\mu$ M),亚油酸(0 - 200 $\mu$ M),GW9508 $\mu$ M(0 - 100),ionomycin(2 $\mu$ M),thapsigargin(2 $\mu$ M)或车辆(0.1% DMSO)。所有实验中所使用的脂肪酸浓度都是在健康的和围生的奶牛的浓度范围内。在另一组实验中, 细胞分别用 10 M GW-1100 和 15 min, 2 M U73122, 3 min 或 vehicle (0.1% DMSO)孵育 15 分钟, 然后用 300 M 油酸, 100 M 亚油
-------------	---

	酸或 10 M GW9508 进行刺激。细胞荧光(Ca <sup>2+</sup> )采用 LS55 分光荧光计，在 509 nm 发射时采用 340/380 nm 双波长激发。Cuvette 温度保持在 37 摄氏度，持续搅拌。
<b>动物实验</b>	在 DMSO 中制备 GW1100 (GW1100)，用盐水或 PBS 稀释。 老鼠：雄性老鼠(年龄 4 周)在 23-24 C 的笼子里，有 12 小时的光暗循环(从早上 8 点到晚上 8 点)，还有食物和水。DHA (50 g/小鼠)，选择性 GPR40-agonist GW9508 (1.0-25 g/小鼠)和 GPR40 拮抗剂 GW1100 (1-10 g/小鼠)在 1% DMSO 中溶解，在 von Frey 测试前用生理盐水稀释溶液(1% DMSO 最终浓度)。GW9508 的剂量是根据我们之前的出版物选择的，而 GW-1100 是根据之前的报告和我们的初步实验选择的。在非麻醉状态下，DHA 和 GW9508 通过脑室(i.c.v.)在 CFA 注射前 10 分钟进行，而 GW1100 则在 GW9508 注射前通过 i.c.v.途径 10 min。在 CFA 治疗后，在小鼠的左侧脑室中，每天两次(9 点和 19 点)注射黄曲霉素(5 和 15 nmol/小鼠)，这是一种细胞周期依赖性激酶抑制剂。

**【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。