



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **GW9508**
CAS 号: **885101-89-3**
产品货号: **S51531**

生物活性:				
Description	GW9508 是一种有效的选择性 G 蛋白偶联受体 FFA1 (GPR40) 和 GPR120 激动剂, pEC50 值分别为 7.32 和 5.46。GW9508 对 GPR40 的选择性是 GPR120 的 100 倍左右, 对其他 GPCR, 激酶, 蛋白酶, 整合蛋白和 PPAR 无活性。GW9508 是一种葡萄糖敏感性胰岛素促分泌剂和 ATP 敏感性钾 (KATP) 通道开放剂。GW9508 具有抗炎和抗动脉粥样硬化活性。			
IC50 & Target	pEC50: 7.32 (GPR40) and 5.46 (GPR120)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CHO	EC50	13 nM	Agonist activity at human GPR40 expressed in CHO cells by calcium flux assay
	CHO	EC50	99 nM	Agonist activity at rat GPR40 expressed in CHO cells by calcium flux assay
In Vitro	GW9508 在表达 GPR40 (pEC50 为 7.32) 或 GPR120 (pEC50 为 5.46) 的 HEK-293 细胞中刺激细胞内 Ca²⁺ 动员, 但在亲代 HEK-293 细胞系中没有[1]。 在高葡萄糖水平 (25 mM) 下, GW9508 浓度依赖性增加葡萄糖刺激产生的胰岛素分泌 (pEC50 为 6.14)。与单独使用 25 mM 葡萄糖相比, 在存在 25 mM 葡萄糖的情况下, 使用 20 μM GW9508 可使胰岛素分泌增加 1.52 倍。GW9508 (10 μM) 增强 MIN6 细胞胰岛素分泌的能力随着葡萄糖浓度的增加而显著增强[1]。 GW9508 抑制百日咳毒素敏感细胞中的 CCL17 和 CCL5 表达方式。GW9508 的抑制作用可通过使用 RNA 干扰耗尽 GPR40 来消除。GW9508 进一步抑制在 HaCaT 细胞中由 TNF-α 和 IFN-γ 诱导的 IL-11、IL-24 和 IL-33 的表达。GW9508 还抑制正常人表皮角质形成细胞产生 CCL5 和 CXCL10[2]。			
In Vivo	在重复的半抗原应用模型 (BALB/c 和 C57BL/6 小鼠) 中, 将 200 (μ M) 的 GW9508 局部给药至皮肤可抑制耳朵肿胀, 并通过下调 CCL5 和 CXCL10 分别抑制接触超敏反应[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (287.84 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
		1 mM	2.8784 mL	14.3922 mL
		5 mM	0.5757 mL	2.8784 mL
		10 mM	0.2878 mL	1.4392 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂:			



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.20 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.20 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.20 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀									
参考文献	[1]. Briscoe CP, et al. Pharmacological regulation of insulin secretion in MIN6 cells through the fatty acid receptor GPR40: identification of agonist and antagonist small molecules. Br J Pharmacol. 2006 Jul;148(5):619-28. [2]. Fujita T, et al. A GPR40 agonist GW9508 suppresses CCL5, CCL17, and CXCL10 induction in keratinocytes and attenuates cutaneous immune inflammation. J Invest Dermatol, 2011, 131(8), 1660-1667. [3]. Zhao YF, et al. Activation of ATP-sensitive potassium channels in rat pancreatic beta-cells by linoleic acid through both intracellular metabolites and membrane receptor signalling pathway. J Endocrinol, 2008, 198(3), 533-540. [4]. Suski M, et al. Anti-atherosclerotic action of GW9508 - Free fatty acid receptors activator - In apoE-knockout mice. Pharmacol Rep. 2019 Aug;71(4):551-555.									
完整储备液配制表：										
请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。储备液的保存方式和期限：-80℃, 2 years; -20℃, 1 year. -80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。										
可选溶剂	<table><tr><td rowspan="2">质量 溶剂体积 浓度</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td><td>25 mg</td></tr><tr><td></td><td></td><td></td><td></td></tr></table>	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg				
质量 溶剂体积 浓度	1 mg		5 mg	10 mg	25 mg					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

DMSO	1 mM	2.8784 mL	14.3922 mL	28.7844 mL	71.9611 mL
	5 mM	0.5757 mL	2.8784 mL	5.7569 mL	14.3922 mL
	10 mM	0.2878 mL	1.4392 mL	2.8784 mL	7.1961 mL
	15 mM	0.1919 mL	0.9595 mL	1.9190 mL	4.7974 mL
	20 mM	0.1439 mL	0.7196 mL	1.4392 mL	3.5981 mL
	25 mM	0.1151 mL	0.5757 mL	1.1514 mL	2.8784 mL
	30 mM	0.0959 mL	0.4797 mL	0.9595 mL	2.3987 mL
	40 mM	0.0720 mL	0.3598 mL	0.7196 mL	1.7990 mL
	50 mM	0.0576 mL	0.2878 mL	0.5757 mL	1.4392 mL
	60 mM	0.0480 mL	0.2399 mL	0.4797 mL	1.1994 mL
	80 mM	0.0360 mL	0.1799 mL	0.3598 mL	0.8995 mL
	100 mM	0.0288 mL	0.1439 mL	0.2878 mL	0.7196 mL

源叶