



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: **GW3965 hydrochloride**

CAS 号: **405911-17-3**

产品货号: **S89028**

生物活性:

Description	GW3965 hydrochloride 是肝 X 受体 (LXR) 激动剂, 对 hLXR α 和 hLXR β 的 EC50 分别为 190 nM 和 30 nM。			
IC50 & Target	EC50: 190 nM (hLXR α), 30 nM (hLXR β)[4]			
In Vitro	GW3965 hydrochloride promotes GBM cell death in vitro with enhanced efficacy in EGFRvIII-expressing tumor cells. GW3965 hydrochloride up-regulates expression of the cholesterol transporter gene ABCA1 and the E3 ubiquitin ligase IDOL and reduces LDLR levels[2]. LXR ligands inhibits platelet aggregation and calcium mobilization stimulated by collagen or CRP. GW3965 hydrochloride (1 or 5 μ M) displays a minor inhibitory effect on fibrinogen binding and P-selectin exposure, when platelets are stimulated with 1 μ g/mL CRP. But using higher concentrations of GW3965 hydrochloride (10 μ M) or T0901317 (40 μ M), the levels of fibrinogen and P-selectin on the platelet surface are reduced[3]。			
In Vivo	GW3965 hydrochloride induces an increase of neuroactive steroids in the spinal cord, the cerebellum and the cerebral cortex of STZ-rats, but not in the CNS of non-pathological animals. GW3965 hydrochloride treatment induces an increase of dihydroprogesterone in the spinal cord of diabetic animals in association with an increase of myelin basic protein expression[1]. GW3965 hydrochloride (40 mg/kg, p.o.) strongly induces ABCA1 expression and reduces LDLR expression, and this is accompanied by 59% inhibition of tumor growth, and a 25-fold increase in GBM cell apoptosis in vivo[2]. GW3965 hydrochloride (2 mg/kg, i.v.) increases bleeding time and modulated platelet thrombus formation in vivo[3].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (161.68 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg
			10 mg	
	1 mM	1.6168 mL	8.0839 mL	16.1679 mL
	5 mM	0.3234 mL	1.6168 mL	3.2336 mL
	10 mM	0.1617 mL	0.8084 mL	1.6168 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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: ——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: $\geq$ 2.5 mg/mL (4.04 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (4.04 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.04 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。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: Corn Oil Solubility: 10 mg/mL (16.17 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Mitro, Nico., et al. LXR and TSPO as new therapeutic targets to increase the levels of neuroactive steroids in the central nervous system of diabetic animals. <i>Neurochemistry International</i> (2012), 60(6), 616-621. [2]. Guo, Deliang., et al. An LXR Agonist Promotes Glioblastoma Cell Death through Inhibition of an EGFR/AKT/SREBP-1/LDLR-Dependent Pathway. <i>Cancer Discovery</i> (2011), 1(5), 442-456. [3]. Spyridon, Michael., et al. LXR as a novel antithrombotic target. <i>Blood</i> (2011), 117(21), 5751-5761. [4]. Collins JL, et al. Identification of a nonsteroidal liver X receptor agonist through parallel array synthesis of tertiary amines. <i>J Med Chem.</i> 2002 May 9;45(10):1963-6.

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°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	1 mM	1.6168 mL	8.0839 mL	16.1679 mL	40.4197 mL



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: shyyw@sina.com

DMSO	5 mM	0.3234 mL	1.6168 mL	3.2336 mL	8.0839 mL
	10 mM	0.1617 mL	0.8084 mL	1.6168 mL	4.0420 mL
	15 mM	0.1078 mL	0.5389 mL	1.0779 mL	2.6946 mL
	20 mM	0.0808 mL	0.4042 mL	0.8084 mL	2.0210 mL
	25 mM	0.0647 mL	0.3234 mL	0.6467 mL	1.6168 mL
	30 mM	0.0539 mL	0.2695 mL	0.5389 mL	1.3473 mL
	40 mM	0.0404 mL	0.2021 mL	0.4042 mL	1.0105 mL
	50 mM	0.0323 mL	0.1617 mL	0.3234 mL	0.8084 mL
	60 mM	0.0269 mL	0.1347 mL	0.2695 mL	0.6737 mL
	80 mM	0.0202 mL	0.1010 mL	0.2021 mL	0.5052 mL
	100 mM	0.0162 mL	0.0808 mL	0.1617 mL	0.4042 mL