



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: **AH-7614**
CAS 号: **6326-06-3**
产品货号: **S89628**

生物活性:

Description	AH-7614 是一种有效和选择性的 FFA4 (GPR120) 拮抗剂, 对人, 小鼠和大鼠 FFA4 的 pIC50 值分别为 7.1, 8.1 和 8.1。AH-7614 对 FFA4 的选择性高于 FFA1 (pIC50<4.6)。AH-7614 能够阻断多不饱和 ω -6 脂肪酸亚油酸和 FFA4 激动剂的作用。			
IC50 & Target	pIC50: 7.1 (human FFA4)[1]			
In Vitro	AH-7614 (Compound 39) (0.063-1 μ M) 阻断了在表达 FFA4 的 U2OS 细胞中, 由亚油酸和 FFAR4 激动剂诱导的细胞内 Ca^{2+} 反应[1]。AH-7614 (100 μ M) 消除了 GSK137647A 在 NCI-H716 细胞中增强的葡萄糖刺激的胰岛素分泌[1]。AH-7614 (0.001-10 μ M; 15 min) 阻断了 TUG-891 介导的 FFA4 从细胞表面的内化 (pIC50=7.70) [2]。AH-7614 (10 μ M; 30 分钟) 阻断了激动剂诱导的细胞内肌醇单磷酸盐水平升高和 FFA4 的磷酸化[2]。			
In Vivo	AH7614 (50 μ g; 每 4 天进行一次瘤内注射, 持续 20 天) 可显著抑制小鼠的肿瘤生长。此外, AH7614 (50 μ g; 在表柔比星注射前一天进行瘤内注射) 通过阻断 GPR120 信号通路, 增强癌细胞对化疗的敏感性, 并与表柔比星联合抑制肿瘤进展。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (284.56 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.8456 mL	14.2280 mL
		5 mM	0.5691 mL	2.8456 mL
		10 mM	0.2846 mL	1.4228 mL
	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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (7.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。			
参考文献	[1]. Sparks SM, et, al. Identification of diarylsulfonamides as agonists of the free fatty acid receptor 4			



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

(FFA4/GPR120). Bioorg Med Chem Lett. 2014 Jul 15;24(14):3100-3.
[2]. Watterson KR, et, al. Probe-Dependent Negative Allosteric Modulators of the Long-Chain Free Fatty Acid Receptor FFA4. Mol Pharmacol. 2017 Jun;91(6):630-641.
[3]. Wang X, et, al. Fatty acid receptor GPR120 promotes breast cancer chemoresistance by upregulating ABC transporters expression and fatty acid synthesis. EBioMedicine. 2019 Feb;40:251-262.

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。 -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
DMSO	1 mM	2.8456 mL	14.2280 mL	28.4560 mL	71.1399 mL
	5 mM	0.5691 mL	2.8456 mL	5.6912 mL	14.2280 mL
	10 mM	0.2846 mL	1.4228 mL	2.8456 mL	7.1140 mL
	15 mM	0.1897 mL	0.9485 mL	1.8971 mL	4.7427 mL
	20 mM	0.1423 mL	0.7114 mL	1.4228 mL	3.5570 mL
	25 mM	0.1138 mL	0.5691 mL	1.1382 mL	2.8456 mL
	30 mM	0.0949 mL	0.4743 mL	0.9485 mL	2.3713 mL
	40 mM	0.0711 mL	0.3557 mL	0.7114 mL	1.7785 mL
	50 mM	0.0569 mL	0.2846 mL	0.5691 mL	1.4228 mL
	60 mM	0.0474 mL	0.2371 mL	0.4743 mL	1.1857 mL
	80 mM	0.0356 mL	0.1778 mL	0.3557 mL	0.8892 mL
	100 mM	0.0285 mL	0.1423 mL	0.2846 mL	0.7114 mL