



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

产品名称: **GLPG0974**
CAS 号: **1391076-61-1**
产品货号: **S89889**

生物活性:

Description	GLPG0974 is a free fatty acid receptor-2 (FFA2/GPR43) antagonist with an IC50 of 9 nM.			
IC50 & Target	IC50: 9 nM (GPR43)[1]			
In Vitro	GLPG0974 能够在体外强烈抑制醋酸盐诱导的嗜中性粒细胞迁移,并在人全血测定中证明能够抑制基于嗜中性粒细胞的药效学 (PD) 标记物 CD11b 激活特异性表位[AE][1]。			
In Vivo	GLPG0974 在大鼠中显示出优异的药代动力学特性,生物利用度为 47%,口服给药 5 和 30 mg/kg 后血浆暴露呈线性增加。口服剂量增加后观察到的半衰期延长与在人类中获得长靶点覆盖的项目目标一致[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (412.37 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
				10 mg
		1 mM	2.0619 mL	10.3093 mL
		5 mM	0.4124 mL	2.0619 mL
		10 mM	0.2062 mL	1.0309 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: ——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: 5 mg/mL (10.31 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 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 50.0 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 ddH ₂ O 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: 5 mg/mL (10.31 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 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 50.0 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: ≥ 5 mg/mL (10.31 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 50.0 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]. Pizzonero M, et al. Discovery and optimization of an azetidine chemical series as a free fatty acid receptor 2 (FFA2) antagonist: from hit to clinic. J Med Chem. 2014 Dec 11;57(23):10044-57.
------	---

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, 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.0619 mL	10.3093 mL	20.6186 mL	51.5464 mL
	5 mM	0.4124 mL	2.0619 mL	4.1237 mL	10.3093 mL
	10 mM	0.2062 mL	1.0309 mL	2.0619 mL	5.1546 mL
	15 mM	0.1375 mL	0.6873 mL	1.3746 mL	3.4364 mL
	20 mM	0.1031 mL	0.5155 mL	1.0309 mL	2.5773 mL
	25 mM	0.0825 mL	0.4124 mL	0.8247 mL	2.0619 mL
	30 mM	0.0687 mL	0.3436 mL	0.6873 mL	1.7182 mL
	40 mM	0.0515 mL	0.2577 mL	0.5155 mL	1.2887 mL
	50 mM	0.0412 mL	0.2062 mL	0.4124 mL	1.0309 mL
	60 mM	0.0344 mL	0.1718 mL	0.3436 mL	0.8591 mL
	80 mM	0.0258 mL	0.1289 mL	0.2577 mL	0.6443 mL
	100 mM	0.0206 mL	0.1031 mL	0.2062 mL	0.5155 mL