



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: **G-1 GPER inhibitor; G-1**
CAS 号: **881639-98-1**
产品货号: **T25413**

生物活性:				
Description	G-1 is a nonsteroidal, high-affinity and selective agonist of GPR30 with a K_i of 11 nM.			
IC50 & Target	K_i : 11 nM (GPR30)[1]			
In Vitro	G-1 是一种非甾体类、高亲和力和选择性的 GPR30 激动剂, K_i 为 11 nM[1]。 用 G-1 (10 μM 和 100 μM) 处理 48 和 72 小时可显著降低细胞增殖 ($P < 0.001$)。在 72 小时, G-1 的 IC50 值计算为 20 μM。用浓度为 20 μM 的 G-1 处理 A549 细胞显示细胞凋亡显著增加, 与其抗增殖作用一致 ($P < 0.001$)[2]。 G-1 处理 24 小时后 H295R 细胞的细胞周期分析表明细胞周期停滞在 G2 期。G-1 的存在增加 Bax 表达, 同时减少 Bcl-2[3]。			
In Vivo	伤后 14 天的结果显示, 与其他组相比, G-1 组的 Basso 小鼠量表 (BMS) 评分显著更高 ($P < 0.05$)。计数横截面 caspase-3 阳性细胞数, G-1 组阳性细胞数较其他组少 ($P < 0.05$), 两组比较无差异 ($P > 0.05$)[1]。 从处理后第 14 天起, G-1 给药产生了肿瘤体积的统计学显著减少。与载体处理的动物相比, 用 G-1 处理三周后收获的移植肿瘤显示肿瘤重量显著降低[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (121.28 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	2.4255 mL	12.1277 mL
		5 mM	0.4851 mL	2.4255 mL
		10 mM	0.2426 mL	1.2128 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: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.06 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。 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 (6.06 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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 (6.06 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 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。 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： 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 5 mg/mL (12.13 mM); 悬浊液; 超声助溶				
参考文献	[1]. Cheng Q, et al. G-1 exerts neuroprotective effects through G protein-coupled estrogen receptor 1 following spinal cord injury in mice. Biosci Rep. 2016 Aug 31;36(4). pii: e00373. [2]. Kurt AH, et al. Oxidative/antioxidative enzyme-mediated antiproliferative and proapoptotic effects of the GPER1 agonist G-1 on lung cancer cells. Oncol Lett. 2015 Nov;10(5):3177-3182. [3]. Chimento A, et al. GPER agonist G-1 decreases adrenocortical carcinoma (ACC) cell growth in vitro and in vivo. Oncotarget. 2015 Aug 7;6(22):19190-203.				
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	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4255 mL	12.1277 mL	24.2554 mL	60.6384 mL
	5 mM	0.4851 mL	2.4255 mL	4.8511 mL	12.1277 mL
	10 mM	0.2426 mL	1.2128 mL	2.4255 mL	6.0638 mL
	15 mM	0.1617 mL	0.8085 mL	1.6170 mL	4.0426 mL
	20 mM	0.1213 mL	0.6064 mL	1.2128 mL	3.0319 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: shyysw@sina.com

	25 mM	0.0970 mL	0.4851 mL	0.9702 mL	2.4255 mL
	30 mM	0.0809 mL	0.4043 mL	0.8085 mL	2.0213 mL
	40 mM	0.0606 mL	0.3032 mL	0.6064 mL	1.5160 mL
	50 mM	0.0485 mL	0.2426 mL	0.4851 mL	1.2128 mL
	60 mM	0.0404 mL	0.2021 mL	0.4043 mL	1.0106 mL
	80 mM	0.0303 mL	0.1516 mL	0.3032 mL	0.7580 mL
	100 mM	0.0243 mL	0.1213 mL	0.2426 mL	0.6064 mL



源叶