

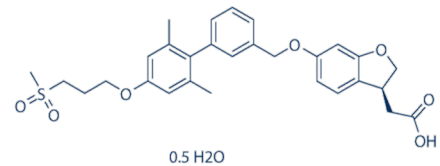
TAK875 (GPR激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SD0038-10mM	TAK875 (GPR激动剂)	10mM×0.2ml
SD0038-5mg	TAK875 (GPR激动剂)	5mg
SD0038-25mg	TAK875 (GPR激动剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-[(3S)-6-[[3-[2,6-dimethyl-4-(3-methylsulfonylpropoxy)phenyl]phenyl]methoxy]-2,3-dihydro-1-benzofuran-3-yl]acetic acid;hydrate
简称	TAK875
别名	TAK 875, TAK-875, AK174922, BC600332, D10567
中文名	N/A
化学式	C ₂₉ H ₃₂ O ₇ S·1/2H ₂ O
分子量	533.63
CAS号	1374598-80-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 5mg/ml
溶液配制	5mg加入0.94ml DMSO, 或每5.34mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD0038-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	TAK-875是一种选择性GPR40激动剂, 在表达人GPR40的CHO细胞系中EC ₅₀ 为14nM, 比油酸有效400倍。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	GPR40	—	—	—	—
IC ₅₀	14nM(EC ₅₀)	—	—	—	—
体外研究	TAK-875表现出有效的激动剂活性, 并对人GPR40受体表现出高结合亲和力, K _i 为38nM。TAK-875对大鼠GPR40受体表现出较弱的亲和力, K _i 为140nM。TAK-875表现出良好的选择性, 其对FFA受体家族的其他成员几乎没有激动作用, EC ₅₀ >10μM。TAK-875治疗诱导CHO-hGPR40中细胞内IP的产生浓度依赖性增加, EC ₅₀ 为72nM, 比需要更高配体浓度以激活受体的内源性配体的激动剂油酸(EC ₅₀ 为29.9μM)更有效。在hGPR40缺失的对照组CHO细胞中, 无论是TAK-875或是油酸, 都不能诱发IP应答。与Gqα介导的信号通路激活一致, TAK-875增加胰岛β细胞中葡萄糖依赖性胰岛素分泌。TAK-875对GPR40/FFA1延长的刺激不会引起胰岛β细胞功能障碍或诱导细胞凋亡。				
体内研究	在糖尿病大鼠模型中, TAK-875以0.3-3mg/kg单剂量口服给药降低血糖波动, 并且口服葡萄糖刺激1小时之前, TAK-875给药能够增加口服葡萄糖耐量试验中的胰岛素分泌。在2型糖尿病N-STZ-1.5大鼠体内, TAK-875(1-10mg/kg p.o.)给药明显提高葡萄糖耐受性, 并增加胰岛素分泌。此外, 在雄性Zucker糖尿病肥胖大鼠体内, TAK-875(10mg/kg, p.o.)显著增加血浆胰岛素水平, 并降低空腹高血糖, 然而在禁食的正常Sprague-Dawley大鼠体内, TAK-875即使在30mg/kg剂量, 也不增强胰岛素分泌, 且不会引起低血糖。				
临床实验	N/A				
特征	能够比油酸更有效地激活hGPR40。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	将稳定表达人GPR40的CHO细胞接种, 并在5% CO ₂ 于37°C下培养过夜。然后, 细胞在加样缓冲液(记录培养基包含2.5μg/ml荧光钙指示剂Fluo 4-AM, 2.5mM丙磺舒和0.1%无脂肪酸的BSA)中于37°C下培养60分钟。将不同浓度的TAK-875加入到细胞中, 加入后细胞内Ca ²⁺ 浓度的增加通过FLIPRT系统监测90秒。TAK-875的EC ₅₀ 值通过Prism 5软件获得。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	接受口服葡萄糖耐量试验的雌性Wistar肥胖大鼠
配制	在0.5%甲基纤维素中配制
剂量	~3mg/kg
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

1. Nobuyuki Negoro, et al. ACS Med Chem Lett, 2010, 1(6), 290-294.
2. Tsujihata Y, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2011, 339(1), 228-237.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD0038-10mM	TAK875 (GPR激动剂)	10mM×0.2ml
SD0038-5mg	TAK875 (GPR激动剂)	5mg
SD0038-25mg	TAK875 (GPR激动剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01