



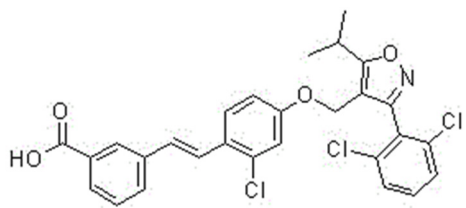
## GW4064 (FXR激动剂)

| 产品编号        | 产品名称            | 包装         |
|-------------|-----------------|------------|
| SF1150-10mM | GW4064 (FXR激动剂) | 10mM×0.2ml |
| SF1150-5mg  | GW4064 (FXR激动剂) | 5mg        |
| SF1150-25mg | GW4064 (FXR激动剂) | 25mg       |

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

|        |  |
|--------|--|
| 化学名    | 3-[(E)-2-[2-chloro-4-[[3-(2,6-dichlorophenyl)-5-propan-2-yl]-1,2-oxazol-4-yl]methoxy]phenyl]ethenyl]benzoic acid |
| 简称     | GW4064   |
| 别名     | GW 4064, GW-4064   |
| 中文名    | N/A  |
| 化学式    | C <sub>28</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>3</sub> NO <sub>4</sub>  |
| 分子量    | 542.84   |
| CAS号   | 278779-30-9  |
| 纯度     | 98%  |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml  |
| 溶液配制   | 5mg加入0.92ml DMSO, 或每5.43mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF1150-10mM用DMSO配制。  |



#### ➤ 生物信息:

|      |   |   |   |   |   |
|------|---|---|---|---|---|
| 产品描述 | GW4064是一种farnesoid X receptor (FXR)激动剂, CV1细胞系中EC50为65nM。   |   |   |   |   |
| 信号通路 | Others  |   |   |   |   |
| 靶点   | FXR   | — | — | — | — |
| IC50 | 65nM(EC50)  | — | — | — | — |
| 体外研究 | GW 4064是一种完全激动剂, 在转染有鼠源和人源FXR表达载体以及确定的报告基因的CV-1细胞中, EC50分别为80和90。GW 4064直到1μM浓度对其它核受体也没有活性, 包括维甲酸受体。因此, GW 4064是一种强有效和选择性的非类固醇FXR激动剂。 |   |   |   |   |
| 体内研究 | 大鼠体内药代动力学实验显示GW 4064口服生物利用度为10%, t1/2=3.5小时。 Fisher大鼠按剂量填喂给药。7天之后, GW 4064处理的大鼠血清甘油三酯下降并具有剂量依赖特性, ED50=20mg/kg。                       |   |   |   |   |
| 临床实验 | N/A   |   |   |   |   |
| 特征   | N/A   |   |   |   |   |

#### ➤ 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      | CV1细胞培养在DMEM高糖培养基中, 转染前72小时收集细胞并接种在不含酚红的DMEM-F12培养基中, 含有5%木炭/葡聚糖处理过的胎牛血清和2mM谷氨酸盐。转染当天用上述培养基收集CV1细胞然后计数并接种在T-175cm <sup>2</sup> 培养瓶中, 接种密度每瓶1400万细胞然后加入转染混合液。The FuGENE® 6转染体系含有0.55μg pFA-CMV-GAL4-人源FXR LBD表达质粒, 10.92μg (UAS)-tk-荧光素酶报告质粒, 20.75μg pBluescript II KS+和3.82μg人类固醇受体共激活因子(SRC-1)质粒, 孵育之后加入 CV1细胞, 培养箱中孵育过夜。转染后的 CV1 细胞收集在不含酚红的DMEM-F12培养基中, 含有5%木炭/葡聚糖处理过的胎牛血清和2mM谷氨酸盐。将上述细胞按3750个/孔密度加入含有配体的384孔板中。与配体孵育24小时后利用Steady-Glo®荧光素酶检测系统测量荧光素酶表达量。用GW4064X作为对照, 所得数据进行归一化处理。 |

| 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 | Fisher大鼠   |
| 配制   | 0.5%甲基纤维素  |
| 剂量   | 0-100mg/kg |
| 给药方式 | 口服，一天两次    |

➤ **参考文献:**

- 1.Akwabi-Ameyaw A et al., Bioorg Med Chem Lett, 2008, 18(15), 4339-4343.
- 2.Maloney PR, et al., J Med Chem, 2000, 43(16), 2971-2974.

**包装清单:**

| 产品编号        | 产品名称            | 包装         |
|-------------|-----------------|------------|
| SF1150-10mM | GW4064 (FXR激动剂) | 10mM×0.2ml |
| SF1150-5mg  | GW4064 (FXR激动剂) | 5mg        |
| SF1150-25mg | GW4064 (FXR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:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效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表面积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