

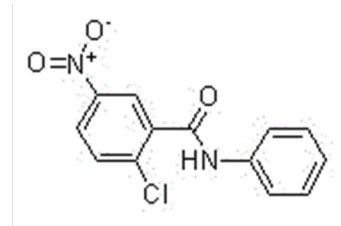
## GW9662 (PPAR拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SC9123-10mM	GW9662 (PPAR拮抗剂)	10mM×0.2ml
SC9123-5mg	GW9662 (PPAR拮抗剂)	5mg
SC9123-25mg	GW9662 (PPAR拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-chloro-5-nitro-N-phenylbenzamide
简称	GW9662
别名	GW-9662, GW 9662, 2-chloro-5-nitrobenzamide
中文名	N/A
化学式	C <sub>13</sub> H <sub>9</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
分子量	276.68
CAS号	22978-25-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 55mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.81ml DMSO, 或每2.77mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC9123-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	GW9662是一种选择性PPAR拮抗剂, 作用于PPAR $\gamma$ , 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为3.3nM, 在细胞中作用于PPAR $\gamma$ 比作用于PPAR $\alpha$ 和PPAR $\delta$ 的功能选择性强100到1000倍。				
信号通路	DNA Damage; Metabolism				
靶点	PPAR $\gamma$	PPAR $\alpha$	PPAR $\delta$	—	—
IC <sub>50</sub>	3.3nM	32nM	2 $\mu$ M	—	—
体外研究	GW9662在PPAR $\gamma$ 上结合Cys(285), PPAR $\gamma$ 是三种PPAR中保守的。GW9662是PPAR $\gamma$ 拮抗剂, 用于抑制脂肪细胞分化。GW9662抑制PPAR $\gamma$ 激活, 且抑制人乳腺癌肿瘤细胞系(MCF7、MDA-MB-468、MDA-MB-231)生长, IC <sub>50</sub> 为20 $\mu$ M-30 $\mu$ M, 说明GW9662的PPAR $\gamma$ 激动剂性能或PPAR $\gamma$ 非依赖性生长抑制机制。Rosiglitazone(50 $\mu$ M)与GW9662(10 $\mu$ M)联用, 作用于MDA-MB-231细胞, 7天后, 统计学上产生较低的存活细胞数。在原代鼠骨髓(BMs)和RAW264.7细胞中, PPAR $\gamma$ 1配体能够抑制RANKL诱导的破骨细胞形成。重要的是, GW9662(2 $\mu$ M)可逆转这些配体的抑制作用, 存在浓度依赖性。GW9662(2 $\mu$ M)作用于BMs, 阻断IL-4对破骨细胞形成的抑制。GW9662(1 $\mu$ M)作用于RAW264.7细胞, 抑制NF- $\kappa$ B的RANKL激活。GW9662(10 $\mu$ M)作用于甲状腺眼病患者的原代前脂肪细胞, 抑制激素和激动剂诱导的脂肪细胞分化。				
体内研究	LPS(1mg/kg, 腹腔注射)预处理大鼠, 显著减弱肾损伤和功能障碍引起的缺血/再灌注(I/R)损伤的所有标记。最值得注意的, GW9662(1mg/kg, 腹腔注射), 可废除LPS的保护作用。				
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	人PPAR $\alpha$ , PPAR $\gamma$ 和PPAR $\delta$ 配体结合域(LBDs)在E.coli中表达, 作为聚组氨酸标记的融合蛋白。在实验缓冲液中, 通过加入所需受体(15nM)到链霉亲和素修饰的SPA珠(0.5mg/ml)浆中, 使受体固定在SPA珠上。混合物在室温下平衡至少1小时, 然后在1 $\times$ 10 <sup>3</sup> g转速下将珠粒沉淀。除去上清液, 轻轻混合, 珠粒再悬浮于新鲜的实验缓冲液。重复离心/重悬浮步骤被, 立即使用所得的受体包被的珠浆液, 或贮存于4 $^{\circ}$ C下长达1周再使用。使用 <sup>3</sup> H]GW2443作为放射性配体, 分别测定与PPAR $\alpha$ 、PPAR $\gamma$ 、PPAR $\delta$ 的竞争性结合。除非另有说明, 所有实验缓冲液为50mM HEPES(pH 7), 50mM NaCl, 5mM CHAPS, 0.1mg/ml BSA和10mM DTT。一些实验中, 使用50mM Tris(pH 8)替换HEPES(pH 7)。

细胞实验	
细胞系	MDA-MB-231细胞
浓度	10 $\mu$ M
处理时间	10天
方法	MDA-MB-231 按 1 $\times$ 10 <sup>5</sup> 细胞 /25cm <sup>3</sup> 组织培养瓶的密度接种。24 小时后(第 0 天)，使用含 Rosiglitazone(50 $\mu$ M)，GW9662(10 $\mu$ M)或两者都有的新鲜培养基置换生长培养基。对照烧瓶中为 0.1%DMSO。通过胰酶消化，收集第0、3、5、7、10天的每种处理条件的细胞，使用台盼蓝染色，使用血球仪计算每瓶细胞总数和存活细胞数。

动物实验	
动物模型	雄性Wistar大鼠
配制	10% (v/v) DMSO
剂量	1mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Leesnitzer LM, et al. Biochemistry, 2002, 41(21), 6640-6650.
- 2.Seargent JM, et al. Br J Pharmacol, 2004, 143(8), 933-937.
- 3.Bendixen AC, et al. Proc Natl Acad Sci USA, 2001, 98(5), 2443-2448.
- 4.Starkey K, et al. J Clin Endocrinol Metab, 2003, 88(1), 55-59.
- 5.Collino M, et al. Kidney Int, 2005, 68(2), 529-536.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC9123-10mM	GW9662 (PPAR拮抗剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC9123-5mg	GW9662 (PPAR拮抗剂)	5mg
SC9123-25mg	GW9662 (PPAR拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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成为高浓度的储备液(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