

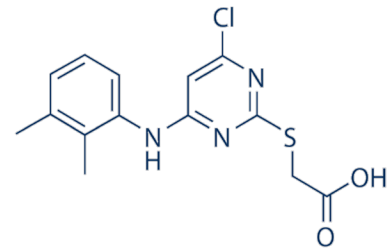
WY-14643 (PPAR激活剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|--------------------|------------|
| SD7189-10mM | WY-14643 (PPAR激活剂) | 10mM×0.2ml |
| SD7189-5mg | WY-14643 (PPAR激活剂) | 5mg |
| SD7189-25mg | WY-14643 (PPAR激活剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|--|
| 化学名 | 2-[4-chloro-6-(2,3-dimethylanilino)pyrimidin-2-yl]sulfanylacetic acid |
| 简称 | WY-14643 |
| 别名 | Pirinixic Acid, CXPTA, WY 14,643, Wy 14643, WY-14,643, WY14,643, Wyeth 14,643, Wyeth-14643 |
| 中文名 | 匹立尼酸 |
| 化学式 | C ₁₄ H ₁₄ ClN ₃ O ₂ S |
| 分子量 | 323.8 |
| CAS号 | 50892-23-4 |
| 纯度 | 98% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 65mg/ml; Ethanol 52mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入1.54ml DMSO, 或每3.24mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7189-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------------------|---|---|---|---|---|
| 产品描述 | WY-14643 (Pirinixic Acid)是一种有效的过氧化物酶体增殖子和PPAR α 激活剂, EC ₅₀ 为1.5 μ M。 | | | | |
| 信号通路 | Metabolism | | | | |
| 靶点 | PPAR α | — | — | — | — |
| IC ₅₀ | 1.5 μ M(EC ₅₀) | — | — | — | — |
| 体外研究 | WY 14643(10 μ M)作用于主动脉平滑肌细胞, 通过抑制NF- κ B信号通路, 几乎完全抑制IL-1诱导的IL-6和前列腺素的产生, 及环氧合酶-2的表达。WY14643(250 μ M)作用于TNF- α 刺激的人类内皮细胞, 显著降低VCAM-1表达水平, 降低52%。使用WY 14643(10 μ M)预处理内皮细胞, 再使用TNF- α 刺激, 降低50% U937细胞粘附。 | | | | |
| 体内研究 | WY 14643(1mg/kg静脉推注)处理大鼠30分钟, 导致左前降支闭塞, 经过局部心肌缺血(25分钟)和再灌注(2小时), 梗死面积显著减少~44%。WY 14643(3mg/kg)处理高脂肪喂养的大鼠, 降低血浆中葡萄糖, 甘油三酯(-16%vs未处理组), Leptin(-52%), 肌肉中甘油三酯(-34%), 总的长链酰基辅酶A(LCACoAs)(-41%)水平。WY14643显著降低内脏脂肪重量和总的肝脏甘油三酯含量, 且不增加体重。WY14643增强整个机体对胰岛素的敏感性。WY 14643增强红色(47%)和白色(63%)肌肉, 及白色脂肪组织(90%)中胰岛素介导的肌肉葡萄糖代谢指数(Rg ¹), 且降低肌肉中甘油三酯和LCACoA的累积。 | | | | |
| 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 | COS1细胞(3×10 ⁵)接种在9厘米直径的实验板中, 其中为补充5%胎牛血清(用葡聚糖包裹的活性炭处理胎牛血清, 除去内源性类固醇)的无酚红培养基。3天后, 更换培养基, 通过磷酸钙沉淀加入CsCl纯化的质粒DNA(10 μ g)。每组实验板包含一个CAT报告基因(1 μ g), 一个表达载体(PPAR, 1 μ g), β -半乳糖苷酶表达载体, PCH110和pBluescribe M13+ DNA作为载体(5 μ g)。转染30分钟后, 加入配体(1000×储存液, 溶于DMSO)。再经过20小时后, 洗涤细胞, 并加入新鲜的配体。再经过24小时后, 通过3次循环冷冻-解冻制备细胞提取物, 并通过归一化CAT实验测定 β -半乳糖苷酶活性。使用0.1 μ Ci [¹⁴ C]Chloramphenicol(50mCi/mmol)通过CAT实验在37°C下进行1小时, 测定对应2个单位 β -半乳糖苷酶活性的提取物通过色谱层析在硅胶 gelTLC板分离乙酰化的Chloramphenicol。除去乙酰化的 |

| |
|------------------------------|
| Chloramphenicol, 在5ml闪烁液中计数。 |
|------------------------------|

| 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 | N/A |
| 配制 | N/A |
| 剂量 | N/A |
| 给药方式 | N/A |

➤ **参考文献:**

1. Issemann I, et al. Nature. 1990, 347(6294), 645-650.
2. Staels B, et al. Nature. 1998, 393(6687), 790-793.
3. Marx N, et al. Circulation, 1999, 99(24), 3125-3131.
4. Wayman NS, et al. FASEB J. 2002, 16(9), 1027-1040.
5. Ye JM, et al. Diabetes, 2001, 50(2), 411-417.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|--------------------|------------|
| SD7189-10mM | WY-14643 (PPAR激活剂) | 10mM×0.2ml |
| SD7189-5mg | WY-14643 (PPAR激活剂) | 5mg |
| SD7189-25mg | WY-14643 (PPAR激活剂) | 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:

- 本产品对人体有毒, 操作时请特别小心, 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