

Catalog Number: CM04308

产品信息

Catalog Number:
CM04308

CAS号:
1621175-65-2

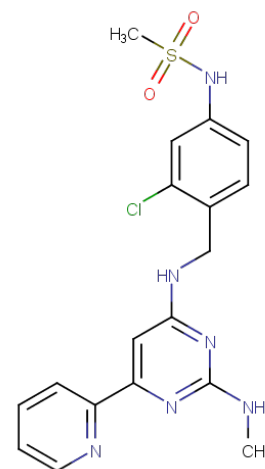
分子式:
C₁₈H₁₉ClN₆O₂S

主要靶点:
GHSR

主要通路:
G 蛋白偶联受体

分子量:
418.9

溶解度:
DMSO:55 mg/mL (131.3 mM)



靶点活性

GPR139 (human):0.8 nM | rat GPR39 :0.4 nM

体外活性

TC-G-1008在一系列激酶上显示出选择性(IC₅₀s>10 μM), 且对相关的ghrelin和neurotensin-1受体没有显著的结合亲和力(IC₅₀s>30 μM)[1]。在HEK293-GPR39细胞中, GPR39-C3是一种正向异构调节因子, 能激活cAMP产生(Gs下游)、IP1积累(Gq下游)、SRF-RE依赖的转录(G12/13下游)和β-arrestin招募。GPR39-C3通过第二次化合物挑战, 以剂量和时间依赖的方式导致对cAMP产生的响应丧失[2]。

体内活性

TC-G-1008对大鼠和小鼠的血浆蛋白结合率分别为99.3%和99.1%。TC-G-1008是首个强效的GPR39激动剂(人类和大鼠受体的EC₅₀s ≤ 1 nM), 能够通过口服在小鼠中生物可用, 并显著诱导急性GLP-1水平。经过一次性口服0.5%甲基纤维素/0.1%Tween 80水悬剂中的10、30和100 mg/kg剂量, TC-G-1008在1至1.5小时内分别达到1.4、6.1和25.3 μM的最大暴露水平[1]。

动物实验

Mice: Mice are given single oral doses of 10, 30, and 100 mg/kg of TC-G-1008[1].

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.