

Canagliflozin ; 卡格列净 ; 坎格列净 ; TA 7284 ; JNJ 28431754

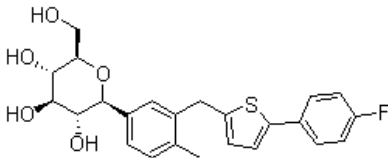
产品编号 : MB1516

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : 类白色粉末

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₂₅ FO ₅ S	结构式	
分子量	444.52		
CAS No.	842133-18-0		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 88 mg/mL (197.96 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : Canagliflozin 是一种选择性的 **SGLT2** 抑制剂, 在 CHOK 细胞中, 抑制 mSGLT2, rSGLT2 和 hSGLT2, IC₅₀ 分别为 2 nM, 3.7 nM 和 4.4 nM。

别名 : JNJ 24831754ZAE; JNJ 28431754; JNJ 28431754AAA; TA 7284 ; Canagliflozin ; 卡格列净 ; 坎格列净

物理性状及指标 :

外观 :类白色粉末

溶解性 :溶于 DMSO(88 mg/mL) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

干燥失重 :≤1.0%

含量 :≥98%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Canagliflozin 是一种高效的, 选择性 SGLT2 抑制剂, 作用于 hSGLT2, 无细胞试验中 IC ₅₀ 为 2.2 nM, 比作用于 hSGLT1 选择性高 413 倍。		
靶点	mSGLT2 (Cell-free assay)	rSGLT2 (Cell-free assay)	hSGLT2 (Cell-free assay)
	2 nM	3.7 nM	4.4 nM
体外研究	Canagliflozin 是新型 C-葡萄糖苷, 具有噻吩环。Canagliflozin 抑制 Na ⁺ 依赖性的 14C-AMG 吸收, 这种作用存在浓度依赖性。Canagliflozin 作用于 CHO-hSGLT1 和 mSGLT1 细胞, 抑制 14C-AMG 吸收, IC ₅₀ 分别为 0.7 μM 和 >1 μM。Canagliflozin 作用于 L6 成肌细胞, 抑制 50% 以下 (非-Na ⁺ -关联的) GLUT 调节的 2H-2-DG 吸收。在 50 μM DNJ 存在时, Canagliflozin (10 μM) 或 phlorizin (3 mM) 单独作用于注射空白对照的卵母细胞, 不影响电流。DMSO 和 Canagliflozin 10 μM 作用于注射 SGLT3-的卵母细胞, 抑制 DNJ 诱导的电流, 分别抑制 15.6% 和 23.4%。		
体内研究	Canagliflozin 处理高脂肪饲料饲喂的 KK(HF-KK)小鼠, 具有显著的抗高血糖效果。Canagliflozin		

按 30 mg/kg 剂量口服处理给药雄性 SD 大鼠，诱导葡萄糖外排，处理 24 小时，每 200 g 体重外排 3,696 mg 糖。药代动力学研究显示 Canagliflozin 口服处理药效更高。Canagliflozin 按 3 和 10 mg/kg 剂量分别静脉注射和口服处理给药雄性 SD 大鼠，测定 AUC_{0-inf, po}, t_{1/2} 和生物有效性分别为 35,980 ng·h/mL, 5.2 小时, 和 85%。Canagliflozin 口服处理，抑制肾小管中的 SGLT2，很可能是因为持续抑制葡萄糖的重吸收。广泛的 UGE 可反映 Canagliflozin 在体内优秀的药代动力学特性，及对 SGLT2 的高效抑制。由于大部分过滤的葡萄糖在肾小管中被 SGLT2 重吸收，所以新型化合物将是很有效的抗糖尿病试剂。Canagliflozin 按 3 mg/kg 剂量单独口服处理高糖高脂肪饲料喂养的 KK(HF-KK)小鼠，显著降低血糖水平，不影响食物吸收。处理 6 个小时，与对照组相比，血糖水平降低 48%。相反，Canagliflozin 作用于正常血糖小鼠，只轻微影响血糖水平。因此，Canagliflozin 在治疗 T2DM 时可控制高血糖，也降低低血糖风险。

美仑相关产品推荐

MB5373	Canagliflozin hemihydrate
--------	---------------------------

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。钠-葡萄糖共-转运蛋白 2(SGLT2)，在近端肾小管内表达，负责来自肾小管官腔被过滤葡萄糖多数的再吸收。Canagliflozin 是一种 SGLT2 的抑制剂，通过抑制 SGLT2，canagliflozin 减低被过滤葡萄糖的再吸收和减低对葡萄糖阈值(RTG)，从而增加尿葡萄糖排泄。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2496 mL	11.2481 mL	22.4962 mL
5 mM	0.4499 mL	2.2496 mL	4.4992 mL
10 mM	0.2250 mL	1.1248 mL	2.2496 mL
50 mM	0.0450 mL	0.2250 mL	0.4499 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	Cell lines: L6 细胞系 Concentrations: 0-10 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 使用从大鼠骨骼肌提取的细胞系 L6,检测 Canagliflozin 作用于葡萄糖载体 1 (GLUT1)活性的效果。细胞培养在含 5.6 mM 葡萄糖，补充 10% 胎牛血清的 DMEM 培养基中，按每孔 3.0×10 ⁵ 个细胞的密度接种到 14 孔板中，在含 5% CO ₂ 的环境中 37°C 下培养 24 小时。使用 Kreb's ringer 磷酸 HEPES buffer (pH 7.4,150 mM NaCl,5 mM KCl,1.25 mM MgSO ₄ ,1.25 mM CaCl ₂ , 2.9 mM Na ₂ HPO ₄ , 10 mM HEPES)漂洗 2 次细胞，然后与 Canagliflozin 溶液(250 μL, 10 uM) 在室温下预温育 5 分钟。加入 50 μL 4.5 mM 2-DG (作为 GLUTs 的底物)/3H-2-DG(0.625 μCi)开始反应，随便在室温下温育 15 分钟。通过吸取温育混合物而使 2-DG 吸收停止。使用冰冻 PBS 立刻冲洗细胞 3 次。使用 0.3 N NaOH 萃取样本,通过液体闪烁法测定放射性。
动物实验	Animal Models: KK (HF-KK) 小鼠 Formulation: 0.2% CMC/0.2% Tween-80 Dosages: 10 mg/kg Administration: 口服处理

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。