

Saxagliptin HCL ; 沙格列汀 ; 沙克列汀盐酸盐

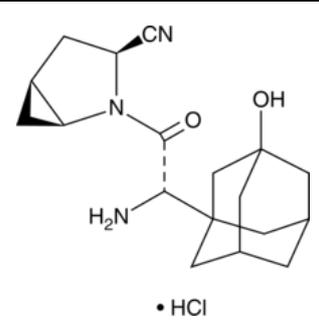
产品编号 : MB1671

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 50MG;200MG;1G

产品形式 : 白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C18H25N3O2.HCl	结构式	 <p>• HCl</p>
分子量	351.87		
CAS No.	709031-78-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 20mg/ml DMF 20mg/ml Ethanol 10mg/ml		
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: 沙格列汀 Saxagliptin(BMS477118)是选择性可逆的 DPP4 抑制剂, 本品是盐酸盐形式。

别名: BMS-477118;Saxagliptin Impurity 5;Saxagliptin hydrochloride;

(1S,3S,5S)-2-[(2S)-Amino(3-hydroxytricyclo[3.3.1.1^{3,7}]dec-1-yl)acetyl]-2-azabicyclo[3.1.0]hexane-3-carbonitrile monohydrochloride;Saxaint-S

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :>98%

λmax :202 nm

含量 :>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

2 型糖尿病治疗药物, 可餐后刺激胰腺产生更多的胰岛素。通过阻断 GLP-I 降解起作用, GLP-I 是摄入食物后在肠内自然产生的激素, 调节胰岛素的分泌, 并可加强周围组织葡萄糖的利用度。沙克列汀单独用药可改善血糖控制, 与二甲双胍、磺酰脲类、噻唑烷二酮类联合用药可增强疗效, 其导致低血糖的危险性较小, 不良反应与安慰剂相似, 显示较好的耐受性。沙克列汀是一种 2 型糖尿病治疗药物, 可餐后刺激胰腺产生更多的胰岛素。属于二肽基肽酶-4(DPP-IV)抑制剂, 作用机制是通过阻断 GLP-I 降解起作用, GLP-I 是摄入食物后在肠内自然产生的激素, 调节胰岛素的分泌, 并可加强周围组织葡萄糖的利用度。沙克列汀单独用药可改善血糖控制, 与二甲双胍、磺酰脲类、噻唑烷二酮类联合用药可增强疗效, 其导致低血糖的危险性较小, 不良反应与安慰剂相似, 显示较好的耐受性。

产品描述

Saxagliptin 是一种选择性的, 可逆的 **DPP4** 抑制剂, **IC50** 为 26 nM。

靶点	<table border="1"> <tr> <td data-bbox="397 212 545 271">DPP-4</td> </tr> <tr> <td data-bbox="397 271 545 329">26 nM</td> </tr> </table>	DPP-4	26 nM
DPP-4			
26 nM			
体外研究	Saxagliptin 抑制 DPP4 的抑制常数 K_i 为 1.3 nM, 比 K_i 分别为 13 和 18 nM 的 vildagliptin 或 sitagliptin (两个其他 DPP4 抑制剂)有效 10 倍。此外, Saxagliptin 对 DPP4 比对 DPP8 或 DPP9 酶(分别为 400-和 75- 倍)具有更高的特异性。Saxagliptin 的活性代谢物的效力比 Saxagliptin 低 2 倍。与一系列其他蛋白酶(sitagliptin 和 vildagliptin 对 DPP4 的选择性分别是 DPP8 和 DPP9 的 >2600 和 <250 倍)相比, Saxagliptin 和其活性代谢物对 DPP4 的抑制均具有较高选择性(>4000 倍)。Saxagliptin 减少肠降血糖激素胰高血糖素样多肽-1 的降解, 从而增强其作用, 并且与改善的 β 细胞功能和胰高血糖素分泌的抑制相关。		
体内研究	在 Zucker ^{fa/fa} 大鼠体内, Saxagliptin 对血糖波动的最大响应与血浆 DPP4 抑制相关, 与对照组相比, 抑制率大约为 60%, 在更高抑制百分比下, 没有额外的抗高血糖作用。与对照组相比, Saxagliptin(0.13-1.3 mg/kg)在 ob/ob 小鼠体内能够高效诱发显著的葡萄糖清除率剂量依赖性增加, oGTT 15 分钟后, Saxagliptin 显著地剂量依赖性提高血浆胰岛素, 同时葡萄糖清除曲线在 oGTT 60 分钟后得到改善。		

美仑相关产品推荐

MB1707	Saxagliptin
--------	-------------

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。沙克列汀 Saxagliptin 是选择性可逆的二肽基肽酶-4(DPP-IV)抑制剂, 是一种 2 型糖尿病治疗药物, 可餐后刺激胰腺产生更多的胰岛素。

【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。