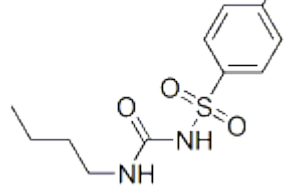


## Tolbutamide; 甲苯磺丁脲

产品编号: MB1691  
质量标准: >99%,BR,可用于细胞培养  
包装规格: 5G;25G  
产品形式: 白色或类白色结晶性粉末  
**基本信息**

分子式	C12H18N2O3S	结构式	
分子量	270.35		
CAS No.	64-77-7		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 54 mg/mL (199.74 mM) Ethanol: 54 mg/mL warmed (199.74 mM) 溶于丙酮、三氯甲烷、氢氧化钠溶液 Water: 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:** 甲苯磺丁脲 Tolbutamide 是第一代钾离子通道阻断剂, 是磺酰脲类口服活性的降糖化合物。

**别名:** HLS 831; Benzenesulfonamide, N-[(butylamino)carbonyl]-4-methyl

### 物理性状及指标:

外观: .....白色或类白色结晶性粉末

熔点: .....126 ~ 130 °C

溶解性: .....DMSO : 54 mg/mL (199.74 mM); Ethanol: 54 mg/mL warmed (199.74 mM); 溶于丙酮、三氯甲烷、氢氧化钠溶液; Water: Insoluble

干燥失重: .....≤0.5%

含量: .....99.0%~101.0%

**储存条件:** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Tolbutamide 是一种钾离子通道抑制剂, 用于治疗 II 型糖尿病。
<b>靶点</b>	Potassium channel
<b>体外研究</b>	Tolbutamide 属于磺酰脲类药物。通过作用胰腺产生胰岛素 (一种体内产生的天然降血糖底物) 来降低血糖并帮助机体更有效的利用胰岛素。它只能帮助机体正常产生胰岛素的这类病人来降低血糖。Tolbutamide 不适用于 I 型糖尿病患者 (机体失去产生胰岛素的能力从而导致调节血糖浓度失调) 或者是糖尿病酮症酸中毒患者 (体内持续高血糖引起的一种急性并发症)。它能同时抑制基底蛋白激酶和环腺苷酸激活的蛋白激酶活性, IC50 浓度为 4 mM。与 Tolbutamide 抑制体外激素 (降肾上腺素和促肾上腺皮质激素) 诱导或者双丁酰环腺苷酸和茶碱共同诱导的脂解作用的 IC50 浓度类似。Tolbutamide 还能够抑制犬类心脏中游离以及膜结合蛋白酶的活性。对脂肪组织的环腺苷酸依赖蛋白激酶活性的抑制作用可能是 Tolbutamide 抗脂解作用的原因。它还能够通过增加 Cx43 的浓度来抑制 C6 胶质细胞的增殖, Cx 43 的浓度与 Cdk 激酶的抑制因子 p21 和 p27 上调所引起的 pRb 磷酸化降低相关。在鼠胰腺 B 细胞中, 胞质核苷酸通过调节抑制和激活受体的协调合作来增强 Tolbutamide ATP 依赖的 K 离子通道 Tolbutamide 能够抑制胰高血糖素诱导的双功能蛋白的磷酸化, 这种抑制作用是剂量依赖的。在储存 10 <sup>-9</sup> M 胰高血糖素的情况下, 加入 2 mM Tolbutamide 能够降低 6 磷

	<p>酸果糖激酶的活性并增加果糖 2, 6 二磷酸酯酶的活性。现有结果显示 Tolbutamide 可能会通过抑制蛋白酶的磷酸化来调节肝脏内在联系磷酸果糖激酶/果糖 2, 6 二磷酸酯酶的活性。</p>
体内研究	<p>450 毫克 Tolbutamide 每天每千克处理细胞, 连续七天, 能够显著增加胰岛素和脂肪细胞的结合。结合曲线反应了受体位点数量的增加而非它们的亲和力。这种效应是与对脂肪组织中胰岛素增强应答相关, 与对照相比, 在有胰岛素存在的前提下, 用 Tolbutamide 处理的动物脂肪细胞能够显著地将更多的葡萄糖转化成脂肪。然而, 胰岛素结合位点的增加仅在大剂量的 Tolbutamide 存在时出现, 但这种剂量下, 会减少胰岛素的整体水平, 包括胰腺的分泌和血清中胰岛素的水平。小的剂量下, 能够通过刺激胰岛素的分泌产生代谢效应的剂量下, 但这种剂量不能提供更多的胰岛素结合位点。</p>

#### 美仑相关产品推荐

MB1691-S	甲苯磺丁脲(标准品)
MB25449	羟基甲苯磺丁脲-d9
MB25454	4-羧基甲苯磺丁脲-d9
MB25451	4-羧基甲苯磺丁脲甲酯-d9
MB25450	4-羧基甲苯磺丁脲乙酯-d9

**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。本品为磺酰脲类口服降血糖药, 对正常人和糖尿病患者均有降血糖作用, 但对胰岛功能丧失者无此作用。主要作用为刺激胰岛  $\beta$  细胞分泌胰岛素。其作用机制是与  $\beta$  细胞膜上的磺酰脲类受体特异性结合, 从而使 ATP 依赖的  $K^+$  通道关闭, 引起膜电位去极化, 使  $Ca^{2+}$  通道开启, 细胞液内  $Ca^{2+}$  浓度升高, 促使胰岛素分泌。还有增强外源性胰岛素的降血糖作用, 加强胰岛素的受体后作用, 而糖耐量的改善可导致血浆胰岛素的浓度降低, 其结果将使胰岛素受体数目增加, 进而导致胰岛素的敏感性增高。

#### 储液配置

体 积 浓度	质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		3.6989 mL	18.4945 mL	36.9891 mL
5 mM		0.7398 mL	3.6989 mL	7.3978 mL
10 mM		0.3699 mL	1.8495 mL	3.6989 mL
50 mM		0.0740 mL	0.3699 mL	0.7398 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p><b>cAMP 酶活实验:</b> 处死饲养的大白鼠 (175-225gm) 后分离附睾脂肪垫并将其剪碎, 在含有 1.27 mM <math>CaCl_2</math> 的克雷布斯碳酸盐缓冲液中, 37°C 培养 2 小时。仅在培养过程中加入 Tolbutamide。清洗培养过的脂肪垫并在冰冷的克雷布斯碳酸盐缓冲液中进行超声处理。4 °C 50, 000g 离心 30 分钟获得的上清液中每毫升含有 0.75 到 1.25 mg 的蛋白用于环腺苷酸蛋白激酶活性的测定。实验反应包括以下试剂, 10 <math>\mu</math>moles pH 7.0 的甘油磷酸钠, 2 <math>\mu</math>moles 氟化钠, 0.4 <math>\mu</math>moles 茶碱, 0.1 <math>\mu</math>moles ethylene glycol bis (<math>\beta</math>-aminoethyl ether)-N, N'-tetraacetic acid, 3 <math>\mu</math>moles 氯化镁, 0.3 mg 组蛋白混合物, 2 nmoles ATP, 必要时 1 nmoles 环腺苷酸, 和 0.05 ml 上清液。</p>
细胞实验:	<p><b>Cell lines:</b> C6 胶质瘤细胞系 <b>Concentrations:</b> 400 <math>\mu</math>M <b>Incubation Time:</b> 24 小时</p>

	<b>Method:</b> 每次实验前, C6 胶质瘤细胞都要在 37℃、无血清的 DMEM 培养基中至少培养 24 小时。再用 Tolbutamide 处理细胞, 浓度为 400μM 于无血清培养基, 孵育 24 小时。孵育条件为 37 °C, 95%空气/5%二氧化碳, 湿度为 90–95%。
<b>动物实验:</b>	<b>Animal Models:</b> 雄性白化病 Wistar 大鼠(200-300 g) <b>Formulation:</b> 做成粉末与食物混合 <b>Dosages:</b> 450 mg/kg <b>Administration:</b> 口服, 连续七天

**【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。