# Dapagliflozin

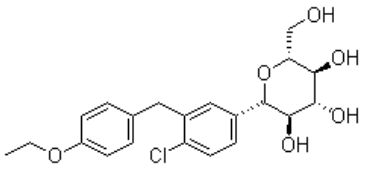
产品编号：MB1917

质量标准：>97%，BR，生化试剂级

包装规格：100MG;1G

产品形式：powder

**基本信息**

| | | | |
|---|---|---|---|
| 分子式 | C21H25ClO6 | 结构式 |  |
| 分子量 | 408.87 | | |
| CAS No. | 461432-26-8 | | |
| 储存条件 | -20℃，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO：82 mg/mL (200.55 mM) | | |
| | Water ：Insoluble | | |
| | Ethanol：17 mg/mL (41.57 mM) | | |
| 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：**Dapagliflozin 是一种 **SGLT2** 的抑制剂，为治疗 2 型糖尿病的药物。

**别名：**BMS-512148；达格列净;达格列嗪

**物理性状及指标：**

外观：.....powder

溶解性：.....DMSO：82 mg/mL (200.55 mM)；Water ：Insoluble；Ethanol：17 mg/mL (41.57 mM)

含量：.....>97%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

**生物活性**

| | |
|---|---|
| **产品描述** | Dapagliflozin 是一种有效的，选择性的 **hSGLT2** 抑制剂，**EC50** 为 1.1 nM，比作用于 hSGLT1 选择性高 1200 倍。Phase 4。 |
| **特性** | Dapagliflozin 是第一类刺激血糖的药物，作用于正常大鼠比其他 SGLT2 抑制剂更有效。 |
| **靶点** | hSGLT2 (CHO cells)<br>1.1 nM(EC50) |
| **体外研究** | Dapagliflozin 对 hSGLT1 不敏感，IC50 是 hSGLT2 的 1200 倍。Dapagliflozin 作用于 hSGLT2 比 Phlorizin 效果高 32 倍。作用于 hSGLT1 比 Phlorizin 效果低 4 倍。Dapagliflozin 高度选择性抗 GLUT 转运蛋白，20 μM Dapagliflozin 在无蛋白 buffer 中抑制达 8-9%，在 4%牛血清蛋白存在时没有抑制效果。Dapagliflozin 可渗透 Caco-2 细胞膜，可作为 P-糖蛋白（P-gp）底物，但不是 P-gp 抑制剂。10 μM Dapagliflozin 稳定作用于大鼠，犬，猴，人类血清。Dapagliflozin 作用于人类 P450 酶，没有抑制反应，也没有诱导。Dapagliflozin 在体外代谢通路中可参与糖脂化，羟乙基化，脱乙基作用。 |

| | |
|---|---|
| **体内研究** | Dapagliflozin 按 0.1 mg/kg 剂量口服给药高血糖 链脲佐菌素(STZ)大鼠，降低血糖水平，降低达 55%，归因于与糖链相关的代谢稳定。 Dapagliflozin 具有很好的吸收，分布，代谢，排泄(ADME) 谱，且具有口服生物有效性。Dapagliflozin 按 1 mg/kg 剂量作用于正常大鼠，处理 24 小时，造成明显糖尿，这种作用存在剂量依赖性，且提高尿量。Dapagliflozin 作用于 Zucker 糖尿病肥胖(ZDF)大鼠，处理 6 小时后，诱导 尿糖和尿量分泌升高。Dapagliflozin 处理 ZDF 大鼠，2 周后，快速降低葡萄糖水平，且不会对肾脏和肝脏造成毒性。Dapagliflozin 明显缓解多糖症病情发展，使血糖水平降低。Dapagliflozin 可提高胰岛素敏感性,降低 β 细胞质量和修复的胰腺功能。 |

**美仑相关产品推荐**

| | |
|---|---|
| MB1875 | Dapagliflozin propanediol hydrate |

**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。Dapagliflozin 是一种选择性 ,口服有效的肾钠 - 葡萄糖共转运蛋白 2 型( SGLT2 )抑制剂 ,目前正在开发用于治疗 2 型糖尿病( T2DM )。Dapagliflozin 抑制钠 - 葡萄糖转运蛋白 ( SGLT2 ) 的亚型 2，其负责肾脏中至少 90%的葡萄糖重吸收。 阻断该转运蛋白导致通过尿液排出血糖。

**储液配置**

| 体积 / 浓度 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|---|---|---|---|
| 1 mM | 2.4458 mL | 12.2288 mL | 24.4577 mL |
| 5 mM | 0.4892 mL | 2.4458 mL | 4.8915 mL |
| 10 mM | 0.2446 mL | 1.2229 mL | 2.4458 mL |
| 50 mM | 0.0489 mL | 0.2446 mL | 0.4892 mL |

**经典实验操作（仅供参考）**

| | |
|---|---|
| **动物实验** | **Animal Models:** 正常 Sprague Dawley 大鼠或链脲佐菌素诱导的雄性 Sprague Dawley 大鼠<br>**Formulation:** 5% mpyrol,20% PEG400,及 20 mM 磷酸钠<br>**Dosages:** 0.01-10 mg/kg (1 mL/kg)<br>**Administration:** 口服处理 |
| **细胞实验** | 为了进行细胞存活测定，在载体或达格列嗪预处理在 30 分钟缺血中孵育 24 小时后收集细胞，并用台盼蓝染色计数存活细胞。 通过量化相对存活的处理细胞数除以未处理细胞的存活数来确定存活百分比。 |

【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。