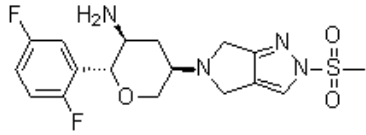


## Omarigliptin ; MK-3102

产品编号 : MB2139  
质量标准 : >98%,BR  
包装规格 : 5MG;25MG  
产品形式 : powder

### 基本信息

分子式	C17H20F2N4O3S	结构式	
分子量	398.43		
CAS No.	1226781-44-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 79 mg/mL (198.27 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 :** Omarigliptin(MK-3102)是 DPP4 高效选择性抑制剂, IC50 值为 1.6nM。

**别名 :** MK-3102 ; 奥格列汀 ; Omarigliptin

### 物理性状及指标 :

外观 : .....粉末

溶解性 : .....DMSO : 79 mg/mL (198.27 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%,

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Omarigliptin (MK-3102)是一种竞争性的、可逆的 <b>DPP-4</b> 抑制剂( <b>IC50</b> = 1.6 nM, <b>Ki</b> = 0.8 nM)。在所有检测的蛋白酶中, 包括 QPP, FAP, PEP, DPP8 和 DPP9 等, 对 DPP-4 具有高选择性, 具有微弱的离子通道活性 ( IC50 > 30 μM at IKr, Cay1.2, and Nay1.5 )。		
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>DPP-4 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>1.6 nM</td> </tr> </table>	DPP-4 (Cell-free assay)	1.6 nM
DPP-4 (Cell-free assay)			
1.6 nM			
<b>体外研究</b>	Omarigliptin 是一种有效的 DPP-4 抑制剂, 在其他所检测蛋白酶中, 具有高选择性(IC50 > 67 μmol/L), 并具有微弱的离子通道活性, 对 IKr, Cay1.2, and Nay1.5 的 IC50 值大于 30 μM。Omarigliptin 快速地、竞争性地与 DPP-4 活性位点结合, 这一过程具有高度选择性, 是一个可逆的过程, 在血糖过高的情况下, Omarigliptin 可导致胰岛素水平的升高和胰高血糖素水平的降低。		
<b>体内研究</b>	在瘦鼠的口服葡萄糖耐量试验(OGTT)中, 葡萄糖筛选前 1 小时, 口服 Omarigliptin 能显著地、浓度依赖性地降低血糖波动。omarigliptin 的给药浓度依赖性地增加活性 GLP-1 的血药		

浓度。它在雄性 Sprague-Dawley 大鼠和小猎犬中的药代动力学研究显示, omarigliptin 具有低清除率 ( 0.9-1.1 mL/min/kg ); 在稳态下分布容积为 0.8-1.3 L/kg ; 终末半衰期长, 约为 11-22 h。在犬类和大鼠中, omarigliptin 的口服生物利用度高, 近乎 100%。在研究期间, omarigliptin 耐受良好, 没有观测到死亡率或生理指标的明显变化。在受试者单次口服 25 mg 的 omarigliptin 后, omarigliptin 在体内迅速被吸收, 在 1 小时内达到峰浓度 (Cmax)750 nmol/L。在受试者中, 生物利用度≥ 74 %。

**美仑相关产品推荐**

MB3462	Linagliptin
MB3850	特力利汀; 氢溴酸替格列汀

**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。Omarigliptin(MK-3102) 是一种高效、选择性和长效的 DPP-4 抑制剂, 是一类降糖药, 可产生持续的 DPP-4 抑制作用, 具有全新的降血糖机制, 同时具有不增加体重、不会引起低血糖反应、不会引起水肿等优越性。其作用机制是通过抑制体内 DPP-4 酶对胰高血糖素样肽-1(GLP-1)的降解作用, 延长 GLP-1 的作用时间, 从而提高血液中内源性 GLP-1 和 GIP 的浓度, 并最终改善血糖控制。GLP-1 为一类肠促胰岛素, 是一类在肠道生成的具有促胰岛素分泌作用的中等长度直链多肽激素, 其作用特点包括: 仅在餐后生成, 促进胰岛 β 细胞分泌胰岛素从而降低血糖, 不会诱发低血糖; 抑制胰岛 α 细胞分泌胰高血糖素; 延迟胃排空从而有利于餐后血糖的控制; 抑制肠道分泌脂蛋白并可能降低作为心血管疾病危险因子的餐后高血脂, 从而具有心脏保护作用。本品仅供科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5099 mL	12.5493 mL	25.0985 mL
5 mM	0.5020 mL	2.5099 mL	5.0197 mL
10 mM	0.2510 mL	1.2549 mL	2.5099 mL
50 mM	0.0502 mL	0.2510 mL	0.5020 mL

**【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。