

## MBX-2982 ; MBX2982

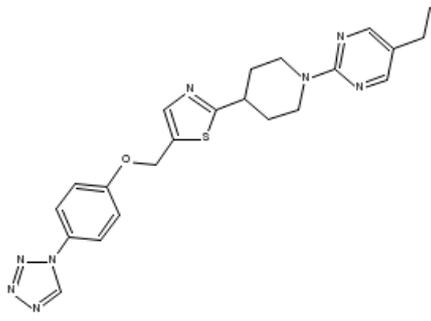
产品编号：MB2413

质量标准：&gt;99%

包装规格：5MG；25MG

产品形式：白色至类白色固体

### 基本信息

分子式	C22H24N8OS	结 构 式	
分子量	448.54		
CAS No.	1037792-44-1		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	溶于 60%聚乙二醇 400 10 mM in DMSO		
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。		

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....溶于 60%聚乙二醇 400；10 mM in DMSO

纯度：.....&gt;99%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性及研究进展：

糖尿病是一种常见的内分泌代谢性疾病，其基本病理特点为胰岛素分泌绝对或相对不足，或外周组织对胰岛素不敏感，引起以糖代谢紊乱为主，包括脂肪、蛋白质代谢紊乱的一种全身性疾病。糖尿病分为 1 型糖尿病、2 型糖尿病、妊娠糖尿病及其他特殊类型的糖尿病，其中 2 型糖尿病患者约占 95%。2 型糖尿病的发病原因是胰岛素抵抗和胰岛素分泌不足的合并存在，总的结果导致患者体内的胰岛素处于一种相对缺乏状态。2 型糖尿病患者(T2DM)胰腺β细胞功能障碍的特征是二型糖尿病的发展,越来越需要代理来改善其功能。GPR119 是 G protein-coupled 受体(GPCR)表示在胰腺β细胞和 enteroendocrine 细胞和取得重大的利益作为一个有前途的下一代的 2 型糖尿病药物的目标。体外研究表明，GPR119 激动剂增加细胞内的 cAMP 水平，从而促进葡萄糖诱导的胰岛素释放和增强的胰岛素样肽 1 (GLP-1)分泌。在 2 型糖尿病动物模型中,GPR119 受体激动剂显示降低血糖水平,保护胰腺β细胞的功能。MBX-2982 是一种选择性的、可用的 G 蛋白偶联受体 119 (GPR119)激动剂。可用于 2 型糖尿病的相关科研领域的探索。

<b>产品描述</b>	MBX-2982 是一种选择性的、可用的 G 蛋白偶联受体 119 (GPR119)激动剂。
<b>靶点&amp;IC50</b>	GPR119
<b>体外研究</b>	在预处理的细胞中，在“慢性孵育/洗涤”实验中，与对照细胞相比，由 IMPX 夹杂物捕获的 cAMP 积累显著增加 (P < 0.01；ANOVA；n = 3-6)，尽管广泛洗涤以除去过量激动剂。AR-23 1453 在与急性刺激(小的 1.82 倍移位)观察到的相似浓度范围内产生持续的响应,PEC50S 分别为 8.67

	±0.11 和 8.93±0.17。同样，观察到的浓度响应 ( 57.54 倍 ) 的大但不太严重的变化，其持续和急性 PEC50 的 7.03±0.13 和 8.79±0.12。
<b>体内研究</b>	为了检查 GLUTag 和原代肠细胞的观察是否具有生理相关性，C57BL / 6 小鼠用 GPR119 激动剂 MXX-9222 以 10 mg/kg 的剂量处理。注意，为了检查直接 GPR119 效应，在本实验中不加入 DPP-IV 抑制剂，但 DPP-IV 抑制剂用于保存血液样品中的活性 GLP-1。在没有葡萄糖负荷的情况下，从用 MXX-292 剂量的小鼠血浆 GLP-1 水平升高，表明 GPR119 介导的 GLP-1 分泌不依赖于葡萄糖。

**美仑相关产品推荐**

MB2865	N-Oleoyl Dopamine(OLDA)	N-油酰多巴胺(ODA)
MB3820	GSK1292263	GSK1292263
MB2481	聚乙二醇 6000	PEG 6000
MB1342	格列吡嗪	Glipizide
MB1956	Nateglinide	那格列奈
MB2048	米格列奈钙	Mitiglinide calcium 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。MBX-2982 是一种口服选择性的 G 蛋白偶联受体 119 (GPR119) 激动剂。可用于 2 型糖尿病的治疗。

**储液配置**

浓度	质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2295 mL	11.1473 mL	22.2946 mL
5 mM	0.4459 mL	2.2295 mL	4.4589 mL
10 mM	0.2229 mL	1.1147 mL	2.2295 mL

**经典实验操作 ( 仅供参考 )**

<b>激酶实验</b>	用 GeloSuror 22F 质粒转染 HEK-GPR119 细胞，并在 24~30h 后进行动态 cAMP 测定。细胞悬浮液通过使用 PBS 洗涤和 ACCututase-处理然后在培养基中再悬浮去除细胞。然后通过离心 ( 300 克，5 分钟 ) 和再悬浮在测定缓冲液 ( Hank 的平衡盐溶液中加入 20 毫米 HEPES 和 0.01% 的无脂肪酸的 BSA，pH 7.4 ) 将细胞洗涤两次。然后将细胞计数并在缓冲液中稀释至 600000 个细胞/ml，然后加入 GeloSoor cAMP 试剂 ( 2% V/V )，并在 20°C 与细胞平衡 2 小时，并进行周期性混合。将 50 L L / 阱的细胞加入到白色底 384 孔板 ( 30000 个细胞/孔 ) 中，并用 EnVIEW 平板阅读器测量基线发光。将 5μL 的 MXX-992 ( 在 DMSO 中连续稀释，然后稀释至 1:100 在测定缓冲液中获得×10 浓缩液 )，手动加入到测定威尔斯中，以达到所述最终浓度。平板在 20°C 孵育，发光以规则间隔读取，以检测同一威尔斯内随时间变化的动态 cAMP 变化。在每个时间点的 cAMP 响应被表示为折叠过度控制 ( 车辆处理的细胞 )。
-------------	--

<b>细胞实验</b>	在 DMSO 中连续稀释 BMX-922，然后在测定缓冲液中稀释 1:100，得到×10 浓缩溶液。 HEK-GPR119 细胞生长在瓶中汇合，细胞悬浮液通过使用 PBS 洗涤和 ACCututase-处理然后在培养基中再悬浮去除细胞。然后，通过离心（227 克、7 分钟、20°C）将细胞洗涤两次，再在温热缓冲液中再悬浮（Hank 的平衡盐溶液加上 20 毫米 HEPES 和 0.01% 无脂肪酸的 BSA，pH 7.4），在第二次洗涤后 37°C 孵育 5 分钟。然后将细胞计数并稀释到 200000 个细胞/ml 中，在温热试验缓冲液中。
<b>动物实验</b>	准备：MXX-922 溶于 15% 聚乙二醇 400 + 85% 的 23.5% 羟丙基-β-环糊精。 动物：小鼠 使用 C57BL / 6 雄性小鼠。通宵禁食，10 周龄雄性小鼠（每组 20 只）通过口服灌胃给药（15% 聚乙二醇 400 + 85% 的 23.5% 羟丙基-β-环糊精）或 MXX-992 10 mg/kg。半数动物（每组 10 只）在复合给药 30 分钟后被 CO2 窒息杀死，并通过心脏穿刺收集血液。为了保持活性的 GLP-1，将 DPP-IV 抑制剂（每 1 毫升血液中的 10μL）预先添加到采血管，并且在心脏穿刺之前，用 DPP-IV 抑制剂冲洗注射器的壁。另一半动物（每组 10 只）在复合给药后 30 分钟口服口服葡萄糖（3 g/kg），并在葡萄糖负荷后 10 分钟处死以采血。用活性 GLP-1（VER 2）试剂盒测定血浆样品中的 GLP-1 水平。

**【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。