

Liraglutide ; 利拉鲁肽

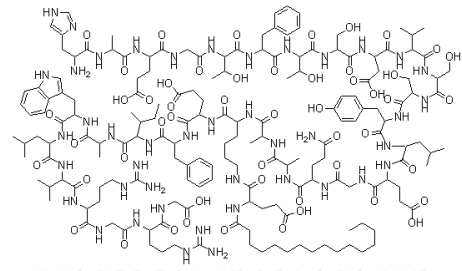
产品编号 : MB5555

质量标准 : >95%,BR

包装规格 : 1MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C172H265N43O51	结 构 式	 <p>His-Ala-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Val-Ser-Ser-Tyr-Leu-Glu-Gly-Gln-Ala-Ala-N6-[N-(1-oxohexadecyl)-Glu]-Lys-Glu-Phe-Ile-Ala-trp-Leu-Val-Arg-Gly-Arg-Gly-OH</p>
分子量	3751.20		
CAS No.	204656-20-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	Water 100 mg/mL (26.65 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 : 利拉鲁肽作为一种新型长效 GLP-1 类似物, 与人 GLP-1 具有 97% 的序列同源性, 人 GLP-1 可以结合并激活 GLP-1 受体。GLP-1 受体为天然 GLP-1 的靶点, GLP-1 是一种内源性肠促胰岛素激素, 能促进胰岛 β 细胞增生和分化, 明显保护并改善胰岛 β 细胞功能。

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :Water 100 mg/mL (26.65 mM)

含量 :>95%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

利拉鲁肽是第一个也是目前唯一一个人 GLP-1 (胰高素样肽-1) 类似物, 在欧洲美国日本已获广泛应用。胰高素样肽-1 是一种肠促胰岛素, 当口服摄入营养物质时, 胰高素样肽-1 可以促进胰岛素的分泌, 但在体内 GLP-1 可被二肽基肽酶-4 (DPP-4) 迅速降解。利拉鲁肽是 GLP-1 受体完全激动剂, 其 97% 的氨基酸序列和人 GLP-1 分子相同。从结构上说, 两个分子间只有两处存在差别, 首先 C16 脂肪酸在第 26 位上通过谷氨酸连接到赖氨酸上。其次, 在第 34 位上赖氨酸被精氨酸所替代, 以确保 C16 侧链只能结合在第 26 位上。脂肪酸侧链可以使利拉鲁肽在血夜中与白蛋白可逆性地结合, 使利拉鲁肽的作用时间延长, 且增强对 DPP-4 酶降解的抵抗, 脂肪酸侧链还可以使利拉鲁肽分子在注射部位自交联成七聚体, 从而延缓其自皮下吸引, 使其作用时间可长达接近 24 小时, 每天注射一次并且可在任意时间注射, 与进餐无关。

利拉鲁肽是 2 型糖尿病治疗领域革命性的药物，适用于单用二甲双胍或磺脲类药物最大可耐受剂量治疗后血糖仍控制不佳的 2 型糖尿病患者，以葡萄糖浓度依赖的方式调节血糖，直接保护 B 细胞，增加胰岛素分泌和减少 α 细胞不当的胰高糖素分泌，通过提高饱腹感和减少热量摄入而降低体重，降低收缩压，越早应用越好。利拉鲁肽与二甲双胍或磺脲类药物联合应用疗效显著，不良反应少。**本品仅适用于相关领域的科研实验。**

产品描述	Liraglutide 是一种长效的胰高血糖素样肽-1 (GLP-1) 激动剂。
靶点	GLP-1 receptor
体外研究	Liraglutide 在人血管内皮细胞 (hVECs) 中，减弱 PAI-1 的诱导作用以及 VAM 的表达。在糖尿病性血管疾病所诱导的内皮细胞功能障碍中，它可能具有一定的保护作用。在体外实验中，liraglutide 依赖于 GLP-1R，抑制 PAI-1 和 VAM 的刺激性表达。
体内研究	在 ApoE ^{-/-} 小鼠模型中，进行血管活性和免疫组化分析的体内研究。Liraglutide 处理后，小鼠的内皮功能得到了显著改善，这一效果依赖于 GLP-1R。Liraglutide 的处理还可增加血管内皮中的内皮一氧化氮合酶 (eNOS)、降低 ICAM-1 的表达。Liraglutide 在 T2D 小鼠模型中，通过增强胰腺 β 细胞的增殖、增加其数量，减轻高血糖症

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 Liraglutide 是一种胰高血糖素样肽-1 (GLP-1) 受体激动剂，用于治疗 2 型糖尿病。可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	0.2666 mL	1.3329 mL	2.6658 mL
5 mM	0.0533 mL	0.2666 mL	0.5332 mL
10 mM	0.0267 mL	0.1333 mL	0.2666 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: 人脐静脉内皮细胞 C11-STH20</p> <p>Concentrations: 100 nM</p> <p>Incubation Time: 16 h</p> <p>Method: C11-STH 细胞在包被有明胶的细胞培养皿中，用添加有青霉素/链霉素、20%FCS、20 μg/ml 内皮细胞生长因子和 20 μg/ml 肝素的 Media-199 培养基进行培养 (37°C)，直至融合。然后，C11-STH 细胞在无血清条件下，处理以 liraglutide(100 nM)16 小时，然后用条件性培养基对 C11-STH 细胞进行 ELISA 分析，测定蛋白表达水平。</p>
-------------	---

动物实验	Animal Models: 无胸腺的裸鼠 Formulation: 生理盐水 Dosages: 300 µg/kg/day Administration: 皮下注射
-------------	--

【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 产品分类：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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。