

Lixisenatide ; 利西拉来 ; 利司那肽

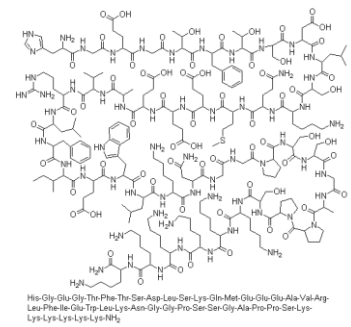
产品编号 : MB5557

质量标准 : >95%,BR

包装规格 : 1MG;5MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C215H347N61O65S	结 构 式	 <p>His-Gly-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Leu-Ser-Lys-Gln-Met-Glu-Glu-Glu-Ala-Val-Arg-Leu-Phe-Ile-Glu-Trp-Leu-Lys-Asn-Gly-Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser-Lys-Lys-Lys-Lys-Lys-Lys-NH₂</p>
分子量	4858.49		
CAS No.	320367-13-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	Water 100 mg/mL (20.58 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 : Lixisenatide 是一种短效的 (一天一次给药) 的 **glucagon-like peptide-1 (GLP-1) receptor** 激动剂(GLP-1RA), 在受体结合研究中, 其对入源 GLP-1 受体的 **IC50** 值为 1.4 nM。

物理性状及指标 :

外观 :类白色至粉色固体

溶解性 :Water 100 mg/mL (20.58 mM)

含量 :>95%

序列 :

His-Gly-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Leu-Ser-Lys-Gln-Met-Glu-Glu-Glu-Ala-Val-Arg-Leu-Phe-Ile-Glu-Trp-Leu-Lys-Asn-Gly-Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser-Lys-Lys-Lys-Lys-Lys-Lys-NH₂

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Lixisenatide 是一种短效的 (一天一次给药) 的 glucagon-like peptide-1 (GLP-1) receptor 激动剂(GLP-1RA), 在受体结合研究中, 其对入源 GLP-1 受体的 IC50 值为 1.4 nM。
靶点	GLP-1R (Cell-free assay) 1.4 nM

体外研究	Lixisenatide 保护 Ins-1 细胞（大鼠来源的 β 细胞系）免于脂质和细胞因子诱导的凋亡。在人类胰岛中，Lixisenatide 还能阻止脂毒性诱导的胰岛素消耗（枯竭）、维持胰岛素的产生、储存以及胰腺 β 细胞功能。在过表达人源 GLP-1 受体的 CHO-K1 细胞中的结合实验表明，Lixisenatide 是一种非常有效的、选择性的 GLP-1 receptor 激动剂，Lixisenatide 的结合亲和力($K_i = 1.33 \pm 0.22$ nM)是人类 GLP-1 ($K_i = 5.09 \pm 1.19$ nM) 的 4 倍多。在大于 80 种不同的结合实验中，Lixisenatide 并不与其他潜在的药物靶标有相关的相互作用，说明其对 GLP-1 受体的高选择性。
体内研究	Lixisenatide 的半衰期为 2-4 小时，相较于长效的 GLP-1 来源的肽段如 liraglutide 和 albiglutide，其半衰期短，所以它被归类于短效的 GLP-1 受体激动剂。Lixisenatide 可显著地改善葡萄糖反应性胰岛素分泌。在健康的血糖正常性的犬类中，单次皮下注射 lixisenatide 将引起口服葡萄糖筛查后血糖浓度依赖性的减少并显著减少餐后血糖波动，而不增加胰岛素浓度。Lixisenatide 在犬类中对餐后血糖波动的作用，至少部分地，与抑制胃排空、延迟肠道葡萄糖的吸收相关。在 db/db 小鼠模型和 ZDF 大鼠模型中，lixisenatide 在其口服葡萄糖筛查后也将引起血糖浓度依赖性的减少，这一活性为葡萄糖依赖性，对生理葡萄糖浓度没有作用。在 db/db 小鼠中，慢性 lixisenatide 给药可阻止糖耐量持续恶化，这与糖基化血红蛋白 (HbA1c) 的显著的浓度依赖性减少相关。在 ZDF 大鼠中，持续 12 周皮下输注 50 μ g/kg/day 的 lixisenatide 可显著地降低基底血糖、改善口服糖耐量。在血糖量正常的大鼠中，不具有降血糖作用、也不改变 HbA1c 水平。Lixisenatide 通过刺激胰岛细胞增殖和再生、抑制胰岛细胞的凋亡，可维持 β 细胞的总量和功能。Lixisenatide 在患有糖尿病的动物中可维持胰腺响应能力。

美仑相关产品推荐

MB0483	Sermaglutide 索玛鲁肽
MB0484	Teduglutide
MB5555	利拉鲁肽

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。Lixisenatide 是胰高血糖素样肽 1 受体 (GLP-1R) 的激动剂，可用于治疗 2 型糖尿病。

储液配置

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	0.2058 mL	1.0291 mL	2.0583 mL
5 mM	0.0412 mL	0.2058 mL	0.4117 mL
10 mM	0.0206 mL	0.1029 mL	0.2058 mL

50 mM	-	-	-
-------	---	---	---

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: Male db/db mice C57BLKS/J-Leprdb/Leprdb Formulation: PBS, pH 7.4 Dosages: 0.01, 0.1, 1, 10 和 100 nmol/kg Administration: i.p.
-------------	---

【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, 否则会严重影响化合物活性, 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
狍狍	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。