

TGR5 Receptor Agonist ; isoxazole

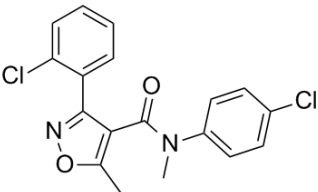
产品编号：MB6112

质量标准：>98%,BR

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	C ₁₈ H ₁₄ Cl ₂ N ₂ O ₂	结 构 式	
分子量	361.22		
CAS No.	1197300-24-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: ≥ 48 mg/mL		
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：TGR5 Receptor Agonist 是 TGR5(GPCR19)激动剂。

别名：4-Isoxazolecarboxamide, 3-(2-chlorophenyl)-N-(4-chlorophenyl)-N,5-dimethyl

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO: ≥150 mg/mL

纯度：.....>98%，BR

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展：

2 型糖尿病（2 型糖尿病）一直是世界和它的重大负担迫切需要制定新的治疗策略。随着我们对 T2DM 病理生理学的认识，针对药物的发现也在发展。G 蛋白偶联受体（GPCRs）最近在糖尿病治疗领域的关注包括肠促胰岛素受体（GLP1R, GIPR），GPR119, FFAR1（GPR40）、FFAR4（GPR120）和胆汁酸受体 GPARB1（TGR5）。其中，GLP-1 受体（GLP1R）可能是具有最佳特征的 GPCR。其他 GPCR，包括游离脂肪酸受体 1（FFAR1，也称为 GPR40），GPR119 和 TGR5 是近年来发展起来的。TGR5 也称为 GPBAR1，M-BAR 或 GPCR19 一种 G 蛋白偶联受体（GPCR）首先被鉴定为 α 细胞表面胆汁酸受体在 2002 年。TGR5 激活在肠内分泌细胞中增加了 GLP-1 的释放。通过促进剂维持血糖的体内平衡，葡萄糖诱导的胰岛素分泌，抑制胰高血糖素释放，延缓胃排空，促进饱腹感，和增加外周组织中的葡萄糖处理。TGR5 也参与褐色的代谢调控脂肪和骨骼肌在能量消耗。因此，TGR5 在调解能量方面的关键参与体内平衡和葡萄糖稳态使其具有吸引力治疗代谢性疾病的潜在目标。在目前，TGR5 激动剂包括两类天然存在的胆汁酸和一些合成的小的分子。TGR5 Receptor Agonist 是 TGR5(GPCR19)激动剂。

产品描述	TGR5 Receptor Agonist 是 TGR5(GPCR19)激动剂。 TGR5 是一种胆汁酸受体，是治疗 2 型糖尿病（T2D）的潜在靶点。 在 U2-OS 细胞测定（PEC50 = 6.8）和黑素细胞（PEC50 = 7.5）中显示出改进的效力。IC50 值： 6.8（PEC50，U2-OS 细胞测定）；7.5（PEC50，黑素细胞） 目标：TGR5 TGR5 受体激动剂对超过 100 的内部和外部 7TM、离子通道、酶、转运蛋白和核激素受体选择性测定，包括 FXR，另一种胆汁酸受体，仅在促炎性细胞分泌的分泌中表现出显著的应答。
-------------	--

tokine TNFalpha (PIC50 = 6.8) 在 LPS (脂多糖) 刺激后的人原代单核细胞中。此外, TGR5 受体激动剂具有良好的理化性质, 对三的正常细胞色素 P450 (CYP450) 异构体 (1A2、2C9、2D6) 或 HEG - 多非利特结合 (PIC50 < 4.3) 没有可测量的活性。然而, 在大鼠药代动力学 (PK) 研究中, TGR5 受体激动剂表现出高的体内清除率 (CL = 85 毫升/分钟/公斤) 和内在清除 (CINT = 48 毫升/分钟/克), 这为观察到的不良暴露提供了合理的解释。因为 TGR5 受体在胃肠道中表达, 其水平与 L 细胞群体密度相应增加, 因此我们相信, 具有 6 个和 7 个系统不良暴露的激动剂是通过直接靶向胃肠道中的 TGR5 受体的良好化合物工具。

美仑相关产品推荐

MB6111	SB756050	SB-756050
MB6107	AMG-3969	AMG3969
MB6088	AZD1656	AZD-1656
MB6159	muraglitazar	BMS-298585
MB3812	T0070907	T-0070907
MB0589	PGPC	1-palmitoyl-2-glutaryl-sn-glycero-3-phosphocholine
MB0225	GW7647	GW-7647
MB0226	GW590735	GW-590735
MB0227	BMS-687453	BMS687453
MB3709	GW0742	GW-0742
MB7303	GW501516	GW-501516
MB5023	GW 9662	2-氯-5-硝基苯甲酰苯胺;GW-9662
MB3813	GSK3787	GSK-3787
MB4844	L-165041	L165041

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。TGR5 Receptor Agonist 是 TGR5(GPCR19)激动剂。可用于 2 型糖尿病科研领域的研究。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7684 mL	13.8420 mL	27.6840 mL
5 mM	0.5537 mL	2.7684 mL	5.5368 mL
10 mM	0.2768 mL	1.3842 mL	2.7684 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。