

Empagliflozin; BI-10773; 艾格列净; 依帕列净; 恩格列净

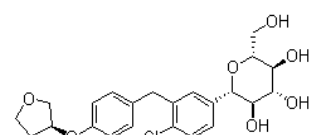
产品编号: MB7205

质量标准: >99%,SGLT-2 抑制剂

包装规格: 100MG;1G;5G

产品形式: solid

基本信息

分子式	C23H27ClO7	结 构 式	
分子量	450.91		
CAS No.	864070-44-0		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 90 mg/mL (199.59 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: Empagliflozin 是一种选择性钠葡萄糖协同转运蛋白-2 (SGLT-2) 抑制剂。

别名: 恩格列净; 艾格列净; 依帕列净; 恩格列净; BI 10773; D-Glucitol,

1,5-anhydro-1-C-[4-chloro-3-[[4-[(3S)-tetrahydro-3-furanyl]oxy]phenyl]methyl]phenyl]-, (1S)-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 90 mg/mL (199.59 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>99%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Empagliflozin (BI-10773)是有效的, 选择性 SGLT-2 抑制剂, IC50 为 3.1 nM,比作用于 SGLT-1, 4, 5 和 6 选择性高 300 倍以上。
靶点	SGLT2
IC50	3.1 nM
体外研究	Empagliflozin 作用于 hSGLT-2 分别比作用于 hSGLT-1(IC50 为 8300 nM), hSGLT-4, hSGLT-5(IC50=1100 nM), 和 hSGLT-6 选择性高 2500 倍以上, 3500 倍以上, 350 倍以上, 和 600 倍以上。10 μM Empagliflozin 对 GLUT1 没有抑制作用。动力学结合实验中, 在缺乏葡萄糖的情况下, [3H]-Empagliflozin 结合到 SGLT-2, 具有高的亲和力, Kd 为 57 nM, [3H]-Empagliflozin 结合到 SGLT-2 的半衰期为 59 分钟。Empagliflozin 与葡萄糖竞争性结合到 SGLT-2。

体内研究	<p>Empagliflozin 按 5 mg/kg 剂量处理狗 24 小时，血浆浓度比测量的 IC50 值高 100 倍以上。Empagliflozin 处理 ZDF 大鼠的总血浆清除率达 43 mL/min/kg，而处理狗则低到 1.8 mL/min/kg。Empagliflozin 处理 ZDF 大鼠和狗的 Cmax 分别为 167 nM 和 17254 nM。Empagliflozin 处理 ZDF 大鼠和狗的终端消除半衰期分别为 1.5 小时和 6.3 小时。Empagliflozin 处理 ZDF 大鼠的生物利用度为 33.2%，而处理狗则高达 89.0%。Empagliflozin 长期处理患糖尿病的大鼠，改善血糖控制和代谢综合征。</p>
-------------	---

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1516	Canagliflozin
MB5373	Canagliflozin hemihydrate
MB7089	Sotagliflozin(LX4211)

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 Empagliflozin 是一种选择性钠葡萄糖协同转运蛋白-2 (SGLT-2) 抑制剂，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		2.2177 mL	11.0887 mL	22.1774 mL
5 mM		0.4435 mL	2.2177 mL	4.4355 mL
10 mM		0.2218 mL	1.1089 mL	2.2177 mL
50 mM		0.0444 mL	0.2218 mL	0.4435 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>[¹⁴C]单糖摄取抑制实验: 使用稳定表达 hSGLT-1, -2, -4, -5 或 -6, 或 rSGLT-1 或-2 的细胞系进行钠依赖性的单糖运输抑制实验。细胞在 200 μL 摄取 Buffer(10 mM HEPES, 137 mM NaCl, 5.4 mM KCl, 2.8 mM CaCl₂, 1.2 mM MgCl₂, 50 μg/ml Gentamycin, 0.1% BSA)中 37°C 下预温育 25 分钟。加入 10 μM Cytochalasin B 和不同浓度的实验化合物, 15 分钟后, 开始摄取实验。加入 0.6 μCi [¹⁴C]标记的单糖, 即 [¹⁴C]标记的 AMG, 葡萄糖, 果糖, 甘露糖, 或肌醇, 在 0.1 mM AMG (或相应的非放射性的单糖) 开始摄取反应。在 37°C 下, 温育 60 分钟 (hSGLT-5), 90 分钟 (hSGLT-4) 或 4 小时 (hSGLT-2) 后, 使用 300 μL PBS 洗涤 细胞三次, 然后间歇震荡 5 分钟溶解在 0.1 N NaOH 中。裂解液与 200 μL MicroScint 40 混合, 震荡 15 分钟, 使用 TopCount NXT 计数放射性。SGLT-4 和 SGLT-5 实验细胞在预处理 Buffer(摄取 Buffer 使用氯化胆碱代替 NaCl)中预温育 25 分钟, 然后加入摄取 Buffer。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HK2 细胞(人体肾脏 PTC 细胞系) Concentrations: ~ 500 Nm Incubation Time: 72 小时 Method: MTS 实验</p>
动物实验	<p>Animal Models: ZDF 大鼠和比格犬</p>

Formulation: 4.4%羟丙基-β-环糊精溶于生理盐水中（静脉注射）或 0.5%羟乙基纤维素（口服）
Dosages: ~2 mL/kg
Administration: 静脉注射或口服处理

【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。