

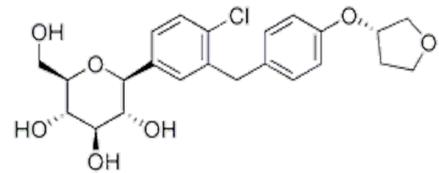
Empagliflozin (SGLT抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2411-10mM	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	10mM×0.2ml
SD2411-5mg	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	5mg
SD2411-25mg	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(2S,3R,4R,5S,6R)-2-[4-chloro-3-[[4-[(3S)-oxolan-3-yl]oxyphenyl]methyl]phenyl]-6-(hydroxymethyl)oxane-3,4,5-triol
简称	Empagliflozin
别名	BI 10773, BI-10773, BI10773, Jardiance
中文名	一帕列净
化学式	C ₂₃ H ₂₇ ClO ₇
分子量	450.91
CAS号	864070-44-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 90mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.11ml DMSO, 或每4.51mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD2411-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Empagliflozin (BI 10773)是一种有效的, 选择性SGLT-2抑制剂, IC ₅₀ 为3.1nM, 比作用于SGLT-1、4、5和6选择性高300倍以上。Phase 3。				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	SGLT2	SGLT5	SGLT6	SGLT1	SGLT4
IC ₅₀	3.1nM	1.1μM	2μM	8.3μM	11μM
体外研究	Empagliflozin作用于hSGLT-2分别比作用于hSGLT-1(IC ₅₀ 为8300nM), hSGLT-4, hSGLT-5(IC ₅₀ =1100nM)和hSGLT-6选择性高2500倍以上, 3500倍以上, 350倍以上和600倍以上。10μM 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, [³ H]-Empagliflozin结合到SGLT-2, 具有高的亲和力, K _d 为57nM, [³ H]-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	Empagliflozin按5mg/kg剂量处理狗24小时, 血浆浓度比测量的IC ₅₀ 值高100倍以上。Empagliflozin处理ZDF大鼠的总血浆清除率达43ml/min/kg, 而处理狗则低到1.8ml/min/kg。Empagliflozin处理ZDF大鼠和狗的C _{max} 分别为167nM和17254nM。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。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	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200μl摄取Buffer(10mM HEPES, 137mM NaCl, 5.4mM KCl, 2.8mM CaCl ₂ , 1.2mM MgCl ₂ , 50μg/ml Gentamycin, 0.1% BSA)中37°C下预温育25分钟。加入10μM 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0.6μCi [¹⁴ C]标记的单糖, 即[¹⁴ C]标记的AMG、葡萄糖、果糖、甘露糖或肌醇, 在0.1mM 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300μl PBS洗涤细胞三次, 然后间歇震荡5分钟溶解在0.1N NaOH中。裂解液与200μl 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。
--	--

细胞实验	
细胞系	HK2细胞(人体肾脏PTC细胞系)
浓度	~500nM
处理时间	72小时
方法	MTS实验

动物实验	
动物模型	ZDF大鼠和比格犬
配制	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)
剂量	~2ml/kg
给药方式	静脉注射或口服处理

➤ **参考文献:**

- 1.Grempler R, et al. Diabetes Obes Metab, 2012, 14(1), 83-90.
- 2.Thomas L, et al. Diabetes Obes Metab, 2012, 14(1), 94-96.
- 3.Panchapakesan U, et al. PLoS One, 2013, 8(2), e54442.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD2411-10mM	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	10mM×0.2ml
SD2411-5mg	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	5mg
SD2411-25mg	Empagliflozin (SGLT抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01