



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **KAD-1229 Calcium Hydrate**
CAS 号: **207844-01-7**
产品货号: **S80529**

生物活性:

Description	Mitiglinide calcium hydrate (KAD-1229) 属于促胰岛素化合物，是一种 ATP 敏感的 K+ 通道 (KATP channel) 拮抗剂。Mitiglinide Calcium hydrate 对 Kir6.2/SUR1 复合物（胰腺-细胞 KATP 通道）具有高度特异性。Mitiglinide Calcium hydrate 可用于 2 型糖尿病的研究。				
IC50 & Target	KATP channel[1]				
In Vitro	Mitiglinide calcium hydrate 以剂量依赖性方式抑制 Kir6.2/SUR1 通道电流 (IC50 值, 100 nM) 但不显著抑制 Kir6.2/SUR2A 或 Kir6.2/SUR2B 即使在高剂量（超过 10 μM）的 COS-1 细胞中也能产生通道电流[1]				
In Vivo	Mitiglinide Calcium hydrate (1-3 mg/kg；口服) 抑制进餐后血浆葡萄糖水平的升高以及进餐后 5 小时血浆葡萄糖水平曲线下面积 (AUC _{glucose})[2].				
	Animal Model:	Pregnant Wistar rats (12 weeks)[2]			
	Dosage:	0.3 mg/kg, 1 mg/kg, 3 mg/kg			
	Administration:	Oral administration			
	Result:	Dose-dependently suppressed AUC _{glucose} levels.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度：25 mg/mL (70.93 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)				
	H2O 中的溶解度：< 0.1 mg/mL (insoluble)				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.8372 mL	14.1860 mL	28.3720 mL
		5 mM	0.5674 mL	2.8372 mL	5.6744 mL
		10 mM	0.2837 mL	1.4186 mL	2.8372 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。				
	储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。				
	动物实验:				
请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。					
以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：					
——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用；					
以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶					
方案 一					
请依序添加每种溶剂：10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.09 mM); 澄清溶液					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合					



	均匀;再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀;然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.09 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。
参考文献	[1]. Y Sunaga, et al. The effects of mitiglinide (KAD-1229), a new anti-diabetic drug, on ATP-sensitive K⁺ channels and insulin secretion: comparison with the sulfonylureas and nateglinide. Eur J Pharmacol. 2001 Nov 9;431(1):119-25. [2]. Kiyoshi Ichikawa, et al. Effect of KAD-1229, a novel hypoglycaemic agent, on plasma glucose levels after meal load in type 2 diabetic rats. Clin Exp Pharmacol Physiol. May-Jun 2002;29(5-6):423-7.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.8372 mL	14.1860 mL	28.3720 mL	70.9300 mL
	5 mM	0.5674 mL	2.8372 mL	5.6744 mL	14.1860 mL
	10 mM	0.2837 mL	1.4186 mL	2.8372 mL	7.0930 mL
	15 mM	0.1891 mL	0.9457 mL	1.8915 mL	4.7287 mL
	20 mM	0.1419 mL	0.7093 mL	1.4186 mL	3.5465 mL
	25 mM	0.1135 mL	0.5674 mL	1.1349 mL	2.8372 mL
	30 mM	0.0946 mL	0.4729 mL	0.9457 mL	2.3643 mL
	40 mM	0.0709 mL	0.3547 mL	0.7093 mL	1.7733 mL
	50 mM	0.0567 mL	0.2837 mL	0.5674 mL	1.4186 mL
	60 mM	0.0473 mL	0.2364 mL	0.4729 mL	1.1822 mL