



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: Ipragliflozin
CAS 号: 761423-87-4
产品货号: S86437

生物活性:						
Description	Ipragliflozin (ASP1941) 是一种有效的, 具有口服活性的选择性 SGLT2 抑制剂, 对人 SGLT2 和 SGLT1, 大鼠 SGLT2 和 SGLT1, 小鼠 SGLT2 和 SGLT1 的 IC50 分别为 7.38 和 1876 nM, 6.73 和 1166 nM, 5.64 和 1380 nM。具有抗糖尿病活性。					
IC50 & Target[1]	hSGLT2 7.38 nM (IC50)	hSGLT1 1876 nM (IC50)	rSGLT2 6.73 nM (IC50)	rSGLT1 1166 nM (IC50)	mSGLT2 5.64 nM (IC50)	mSGLT1 1380 nM (IC50)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description		
	CHO	IC50	7.4 nM	Inhibition of human SGLT2 expressed in CHO cells assessed as [14C]AMG accumulation after 2 hrs by scintillation counting		
In Vitro	Ipragliflozin (1-50 μM) 显著且剂量依赖性地抑制 MCF-7 人乳腺癌细胞系的生长。 在使用 siRNA 敲低 SGLT2 表达后, Ipragliflozin 诱导的细胞增殖减弱被完全取消, 表明 Ipragliflozin 通过抑制 SGLT2 减弱乳腺癌细胞增殖。 BrdU 测定显示高剂量 (50 和 100 μM) Ipragliflozin 显著抑制 MCF-7 细胞的 DNA 合成[2]。 Cell Viability Assay[2]					
	Cell Line:		MCF-7 human breast cancer cell lines			
	Concentration:		1, 10, 50 μM			
	Incubation Time:		24, 48, 72, 96 hours			
	Result:		Decreased the number of MCF-7 cells in a dose-dependent manner.			
	Ipragliflozin 具有抗高血糖作用。Ipragliflozin (0.1-1 mg/kg) 剂量依赖性地抑制血糖水平的升高。 在 STZ 诱导的 1 型糖尿病大鼠中, 该效应在 0.3 和 1 mg/kg 剂量下显著, 而在 KK-Ay 2 型糖尿病小鼠中, 该效应在所有测试剂量下均显著[1]。 Ipragliflozin (0.3 和 1 mg/kg) 在链脲佐菌素诱导的 1 型糖尿病大鼠中显示出重复给药的抗糖尿病作用[1]。					
	In Vivo	Animal Model:		Single Administration[1] Streptozotocin (STZ; 50 mg/kg)-induced type 1 diabetic rats and KK-Ay type 2 diabetic mice		
Dosage:		0.1-1 mg/kg				
Administration:		Single oral administration in the fed condition. Blood glucose levels were then measured for 8 h under fasting conditions.				
Result:		Dose-dependently lowered blood glucose levels, and this effect was significant at all tested doses.				
Animal Model:		Repeated Administration[1] Streptozotocin (STZ; 50 mg/kg)-induced type 1 diabetic rats				
Dosage:		0.3 and 1 mg/kg				
Administration:		Administration orally once daily (at night) for 4 weeks.				



	Result:	Significantly reduced the levels of HbA _{1c} and blood glucose. Pancreatic insulin content was significantly increased at a dose of 1 mg/kg. Urinary glucose excretion was increased dose-dependently, and this was significant at the 1 mg/kg dose.																		
Solvent&Solubility	细胞实验:																			
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (247.25 mM; 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)																			
	* "≥" means soluble, but saturation unknown)																			
	<table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> SolventMassConcentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.4725 mL</td><td>12.3625 mL</td><td>24.7249 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.4945 mL</td><td>2.4725 mL</td><td>4.9450 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2472 mL</td><td>1.2362 mL</td><td>2.4725 mL</td></tr></table>	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.4725 mL	12.3625 mL	24.7249 mL	5 mM	0.4945 mL	2.4725 mL	4.9450 mL	10 mM	0.2472 mL	1.2362 mL	2.4725 mL		
Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration		1 mg	5 mg	10 mg															
	1 mM		2.4725 mL	12.3625 mL	24.7249 mL															
	5 mM		0.4945 mL	2.4725 mL	4.9450 mL															
	10 mM	0.2472 mL	1.2362 mL	2.4725 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 (6.18 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.18 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.18 mM); 澄清溶液																				



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: shyyssw@sina.com

	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 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 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Atsuo Tahara, et al. Pharmacological profile of ipragliflozin (ASP1941), a novel selective SGLT2 inhibitor, in vitro and in vivo. Naunyn Schmiedeberg's Arch Pharmacol. 2012 Apr;385(4):423-36. [2]. Shiho Komatsu, et al. SGLT2 inhibitor ipragliflozin attenuates breast cancer cell proliferation. Endocr J. 2020 Jan 28;67(1):99-106.

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, 2 years; -20°C, 1 year. -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4725 mL	12.3625 mL	24.7249 mL	61.8123 mL
	5 mM	0.4945 mL	2.4725 mL	4.9450 mL	12.3625 mL
	10 mM	0.2472 mL	1.2362 mL	2.4725 mL	6.1812 mL
	15 mM	0.1648 mL	0.8242 mL	1.6483 mL	4.1208 mL
	20 mM	0.1236 mL	0.6181 mL	1.2362 mL	3.0906 mL
	25 mM	0.0989 mL	0.4945 mL	0.9890 mL	2.4725 mL
	30 mM	0.0824 mL	0.4121 mL	0.8242 mL	2.0604 mL
	40 mM	0.0618 mL	0.3091 mL	0.6181 mL	1.5453 mL
	50 mM	0.0494 mL	0.2472 mL	0.4945 mL	1.2362 mL
	60 mM	0.0412 mL	0.2060 mL	0.4121 mL	1.0302 mL
	80 mM	0.0309 mL	0.1545 mL	0.3091 mL	0.7727 mL
	100 mM	0.0247 mL	0.1236 mL	0.2472 mL	0.6181 mL