



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

产品名称: **APD597**
CAS 号: **897732-93-3**
产品货号: **S87719**

生物活性:

Description	APD597 (JNJ-38431055) 是一种口服有效的 GPR119 激动剂。APD597 对 CYP2C9 的抑制作用减弱, IC50 为 5.8 μM。APD597 可用于研究其对 2 型糖尿病的作用。				
In Vitro	APD597 (10 μM) 显著增加 NIT-1 细胞中的 CREB 磷酸化[2]。				
In Vivo	APD597 (20 mg/kg, 口服, 单剂量) 可提高 ICR 小鼠中葡萄糖诱导的总 GLP-1 和 GIP 水平[2]。				
	Animal Model:	4 h-fasted ICR mice with oral glucose load[2]			
	Dosage:	20 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage (p.o.)			
	Result:	Increased the glucose-induced total GLP-1 level by 92%. Increased the glucose-induced GIP level by 169.9%.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (208.53 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	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0853 mL	10.4264 mL	20.8529 mL
		5 mM	0.4171 mL	2.0853 mL	4.1706 mL
		10 mM	0.2085 mL	1.0426 mL	2.0853 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 (5.21 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 ddH ₂ O 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 (5.21 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 (5.21 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，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]. Buzard DJ, et al. Discovery and optimization of 5-fluoro-4,6-dialkoxypyrimidine GPR119 agonists. Bioorg Med Chem Lett. 2014 Sep 1;24(17):4332-4335. [2]. Huan Y, et al. The dual DPP4 inhibitor and GPR119 agonist HBK001 regulates glycemic control and beta cell function ex and in vivo. Sci Rep. 2017 Jun 28;7(1):4351. [3]. Semple G, et al. Discovery of a second generation agonist of the orphan G-protein coupled receptor GPR119 with an improved profile. Bioorg Med Chem Lett. 2012 Feb 15;22(4):1750-1755.																																																							
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	<table><tr><td>质量 溶剂体积 浓度</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td><td>25 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.0853 mL</td><td>10.4264 mL</td><td>20.8529 mL</td><td>52.1322 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.4171 mL</td><td>2.0853 mL</td><td>4.1706 mL</td><td>10.4264 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2085 mL</td><td>1.0426 mL</td><td>2.0853 mL</td><td>5.2132 mL</td></tr><tr><td>15 mM</td><td>0.1390 mL</td><td>0.6951 mL</td><td>1.3902 mL</td><td>3.4755 mL</td></tr><tr><td>20 mM</td><td>0.1043 mL</td><td>0.5213 mL</td><td>1.0426 mL</td><td>2.6066 mL</td></tr><tr><td>25 mM</td><td>0.0834 mL</td><td>0.4171 mL</td><td>0.8341 mL</td><td>2.0853 mL</td></tr><tr><td>30 mM</td><td>0.0695 mL</td><td>0.3475 mL</td><td>0.6951 mL</td><td>1.7377 mL</td></tr><tr><td>40 mM</td><td>0.0521 mL</td><td>0.2607 mL</td><td>0.5213 mL</td><td>1.3033 mL</td></tr><tr><td>50 mM</td><td>0.0417 mL</td><td>0.2085 mL</td><td>0.4171 mL</td><td>1.0426 mL</td></tr><tr><td>60 mM</td><td>0.0348 mL</td><td>0.1738 mL</td><td>0.3475 mL</td><td>0.8689 mL</td></tr></table>	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	1 mM	2.0853 mL	10.4264 mL	20.8529 mL	52.1322 mL	5 mM	0.4171 mL	2.0853 mL	4.1706 mL	10.4264 mL	10 mM	0.2085 mL	1.0426 mL	2.0853 mL	5.2132 mL	15 mM	0.1390 mL	0.6951 mL	1.3902 mL	3.4755 mL	20 mM	0.1043 mL	0.5213 mL	1.0426 mL	2.6066 mL	25 mM	0.0834 mL	0.4171 mL	0.8341 mL	2.0853 mL	30 mM	0.0695 mL	0.3475 mL	0.6951 mL	1.7377 mL	40 mM	0.0521 mL	0.2607 mL	0.5213 mL	1.3033 mL	50 mM	0.0417 mL	0.2085 mL	0.4171 mL	1.0426 mL	60 mM	0.0348 mL	0.1738 mL	0.3475 mL	0.8689 mL
质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg																																																				
1 mM	2.0853 mL	10.4264 mL	20.8529 mL	52.1322 mL																																																				
5 mM	0.4171 mL	2.0853 mL	4.1706 mL	10.4264 mL																																																				
10 mM	0.2085 mL	1.0426 mL	2.0853 mL	5.2132 mL																																																				
15 mM	0.1390 mL	0.6951 mL	1.3902 mL	3.4755 mL																																																				
20 mM	0.1043 mL	0.5213 mL	1.0426 mL	2.6066 mL																																																				
25 mM	0.0834 mL	0.4171 mL	0.8341 mL	2.0853 mL																																																				
30 mM	0.0695 mL	0.3475 mL	0.6951 mL	1.7377 mL																																																				
40 mM	0.0521 mL	0.2607 mL	0.5213 mL	1.3033 mL																																																				
50 mM	0.0417 mL	0.2085 mL	0.4171 mL	1.0426 mL																																																				
60 mM	0.0348 mL	0.1738 mL	0.3475 mL	0.8689 mL																																																				



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

	80 mM	0.0261 mL	0.1303 mL	0.2607 mL	0.6517 mL
	100 mM	0.0209 mL	0.1043 mL	0.2085 mL	0.5213 mL



源叶