



产品货号: S89219

Description	Danuglipron (PF-06882961) 是一种具有口服活性的胰高血糖素样肽-1 受体 (GLP-1R) 激动剂。Danuglipron 具有用于 2 型糖尿病研究的潜力。								
IC50 & Target	GLP-1R[1][2]								
In Vitro	Danuglipron (PF-06882961) 在 cAMP 和 β Arr 通路上均显示出激动剂活性。Danuglipron 是 CS cAMP 测定中的完全激动剂 (EC50 为 13 nM)。Danuglipron 是募集 β Arr2 的部分激动剂 (EC50 为 490 nM) [1]。								
In Vivo	Danuglipron (PF-06882961; 10 mg/kg; 口服; 单剂量) 可降低 hGLP-1R 小鼠模型腹膜内葡萄糖耐量试验 (IPGTT) 后的血糖水平[2]。								
	Danuglipron 在雄性 Wistar 大鼠和雄性食蟹猴体内的药代动力学参数[1]。								
		Dose	C _{max}		AUC _{0-∞}	CL _D	Vd _{ss}	Oral F	
	Species	(mg/kg)	(ng/mL)	T _{max} (h)	(ng h/mL)	(mL/min/kg)	(L/kg)	t _{1/2} (h)	(%)
							0.86 ±	1.13 ±	
	rat	1.0 (iv)	-	-	296 ± 39.8	57.3 ± 8.68	0.38	0.84	-
	rat	5.0 (po)	141	0.5	168	-	-	0.63	11
	rat	100 (po)	2820	0.75	11900	-	-	2.37	39
	monkey	1.0 (iv)	-	-	1240	13.8	0.266	1.89	-
	monkey	5.0 (po)	68.7	1.5	303	-	-	6.92	5
		1150 ±							
monkey	100 (po)	715	3.3 ± 2.5	11000 ± 3500	-	-	6.37	9	
	Animal Model:		C57BL/6 mice expressing humanized GLP-1R[2]						
	Dosage:		10 mg/kg						
	Administration:		po; a single dose						
	Result:		Lowered blood glucose levels following IPGTT.						
Solvent&Solubility	细胞实验:								
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (179.99 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)								
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration		1 mg		5 mg		10 mg	
		1 mM		1.7999 mL		8.9993 mL		17.9986 mL	
		5 mM		0.3600 mL		1.7999 mL		3.5997 mL	
		10 mM		0.1800 mL		0.8999 mL		1.7999 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, 6 months; -20°C, 1 month。 -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。								
	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:									



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

	——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: ≥ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. David A Griffithm, et al. A Small-Molecule Oral Agonist of the Human Glucagon-like Peptide-1 Receptor. J Med Chem. 2022 Jun 23;65(12):8208-8226. [2]. W. GUO, et al. Preclinical pharmacology of low molecular weight GLP-1 receptor agonist XW014.

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。-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	1.7999 mL	8.9993 mL	17.9986 mL	44.9964 mL
	5 mM	0.3600 mL	1.7999 mL	3.5997 mL	8.9993 mL
	10 mM	0.1800 mL	0.8999 mL	1.7999 mL	4.4996 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: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.1200 mL	0.6000 mL	1.1999 mL	2.9998 mL
	20 mM	0.0900 mL	0.4500 mL	0.8999 mL	2.2498 mL
	25 mM	0.0720 mL	0.3600 mL	0.7199 mL	1.7999 mL
	30 mM	0.0600 mL	0.3000 mL	0.6000 mL	1.4999 mL
	40 mM	0.0450 mL	0.2250 mL	0.4500 mL	1.1249 mL
	50 mM	0.0360 mL	0.1800 mL	0.3600 mL	0.8999 mL
	60 mM	0.0300 mL	0.1500 mL	0.3000 mL	0.7499 mL
	80 mM	0.0225 mL	0.1125 mL	0.2250 mL	0.5625 mL
	100 mM	0.0180 mL	0.0900 mL	0.1800 mL	0.4500 mL



源叶