



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: **TC-G 1005**
CAS 号: **1415407-60-1**
产品货号: **S89384**

生物活性:

Description	TC-G 1005 是一种有效, 选择性和口服活性的 TGR5 激动剂, 激活 hTGR5 和 mTGR5 的 EC50 值分别为 0.72 和 6.2 nM。TC-G 1005 可降低小鼠体内葡萄糖水平。				
IC50 & Target	IC50: 0.72 nM (hTGR5); 6.2 nM (mTGR5)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC ₅₀	0.72 nM	Agonist activity at human TGR5 expressed in HEK293 cells incubated for 5.5 hrs by CRE-driven luciferase reporter gene assay	
	HEK293	EC ₅₀	6.2 nM	Agonist activity at mouse TGR5 expressed in HEK293 cells incubated for 5.5 hrs by CRE-driven luciferase reporter gene assay	
In Vitro	TC-G 1005 激活人和小鼠 TGR5, EC50 分别为 0.72 nM 和 6.2 nM[1]。				
In Vivo	TC-G 1005 (25-100 mg/kg; 单次口服) 刺激印记控制区 (ICR) 小鼠中的 GLP-1 分泌[1]。 TC-G 1005 (50 mg/kg; 单次 po) 可使 ICR 小鼠的血糖 AUC0-120 分钟 降低 49%[1]。 TC-G 1005 (50 mg/kg; 单次口服) 显著降低 db/db 小鼠第 4、6、10 和 24 小时的血糖[1]。 TC-G 1005 (5 mg/kg; po) 在大鼠中表现出相当低的血浆暴露, Cmax 为 56 ng/mL, t1/2 为 1.5[1]。				
	Animal Model:		Male ICR mice[1]		
	Dosage:		25, 50, 100 mg/kg		
	Administration:		A single p.o.		
	Result:		Increased the plasma active GLP-1 levels by 31, 96, and 282% at doses of 25, 50, and 100 mg/kg, respectively.		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (83.43 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5033 mL	12.5163 mL	25.0325 mL
		5 mM	0.5007 mL	2.5033 mL	5.0065 mL
		10 mM	0.2503 mL	1.2516 mL	2.5033 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 (6.26 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.26 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]. Duan H, et, al. Design, synthesis, and antidiabetic activity of 4-phenoxy nicotinamide and 4-phenoxy pyrimidine-5-carboxamide derivatives as potent and orally efficacious TGR5 agonists. J Med Chem. 2012 Dec 13;55(23):10475-89. [2]. Urso A, et, al. Bile acids inhibit cholinergic constriction in proximal and peripheral airways from humans and rodents. Am J Physiol Lung Cell Mol Physiol. 2020 Feb 1;318(2):L264-L275.
------	---

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year. -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ 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	2.5033 mL	12.5163 mL	25.0325 mL	62.5814 mL
	5 mM	0.5007 mL	2.5033 mL	5.0065 mL	12.5163 mL
	10 mM	0.2503 mL	1.2516 mL	2.5033 mL	6.2581 mL
	15 mM	0.1669 mL	0.8344 mL	1.6688 mL	4.1721 mL
	20 mM	0.1252 mL	0.6258 mL	1.2516 mL	3.1291 mL
	25 mM	0.1001 mL	0.5007 mL	1.0013 mL	2.5033 mL
	30 mM	0.0834 mL	0.4172 mL	0.8344 mL	2.0860 mL
	40 mM	0.0626 mL	0.3129 mL	0.6258 mL	1.5645 mL
	50 mM	0.0501 mL	0.2503 mL	0.5007 mL	1.2516 mL
	60 mM	0.0417 mL	0.2086 mL	0.4172 mL	1.0430 mL
	80 mM	0.0313 mL	0.1565 mL	0.3129 mL	0.7823 mL