

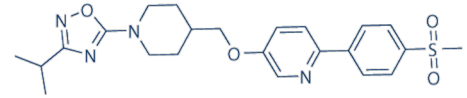
GSK1292263 (GPR激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SD0029-10mM	GSK1292263 (GPR激动剂)	10mM×0.2ml
SD0029-5mg	GSK1292263 (GPR激动剂)	5mg
SD0029-25mg	GSK1292263 (GPR激动剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-[4-[[6-(4-methylsulfonylphenyl)pyridin-3-yl]oxymethyl]piperidin-1-yl]-3-propan-2-yl-1,2,4-oxadiazole
简称	GSK1292263
别名	GSK 1292263, GSK-1292263
中文名	N/A
化学式	C ₂₃ H ₂₈ N ₄ O ₄ S
分子量	456.56
CAS号	1032823-75-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 34mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.10ml DMSO, 或每4.57mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD0029-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	GSK1292263是一种新型GPR119激动剂, 用于治疗2型糖尿病。Phase 2。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	GPR119	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	GSK-1292263通过使用Hypo1从1538种化合物中被选出, 与Hypo1中一致的GSK-1292263的拟合值和估计值分别为8.8和7.7(nM)。				
体内研究	在雄性Sprague-Dawley大鼠体内, GSK-1292263(3-30mg/kg)以单剂量给药在营养素不存在时, 与循环胃肠肽, 包括胰高血糖素样多肽1(GLP-1), 肠抑胃肽(GIP), 多肽YY (PYY)和胰高血糖素的增加水平相关, 在口服葡萄糖耐量测试(OGTT)中, 葡萄糖给药会加强循环胃肠肽的增加。在大鼠静脉内葡萄糖耐量测试中, GSK-129226显著增加胰岛素反应的峰值, 并且与载体对照组相比, 增加30-60%的胰岛素AUC(0-15min), 此处胰岛素的上调与葡萄糖清除率的显著增加相关。在Zucker糖尿病肥胖大鼠的6周研究中, 与空白对照大鼠样本中胰岛素免疫反应性相比, GSK-1292263与胰腺切片中胰岛素免疫反应性在统计学上的显著增加相关。Sprague-Dawley大鼠体内, 高胰岛素-正常血糖钳夹实验中, 胰岛素注射2小时前, GSK-1292263以10或30mg/kg的剂量给药或与载体对照相比, 刺激胰高血糖素分泌, 而不增加血糖水平。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	雄性Sprague-Dawley大鼠
配制	0.9%氯化钠溶液
剂量	3-30mg/kg
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

1. Zhu X, et al. Eur J Med Chem, 2011, 46(7), 2901-2907.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD0029-10mM	GSK1292263 (GPR激动剂)	10mM×0.2ml
SD0029-5mg	GSK1292263 (GPR激动剂)	5mg
SD0029-25mg	GSK1292263 (GPR激动剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01