

## Sitagliptin phosphate monohydrate ; 磷酸西他列汀一水

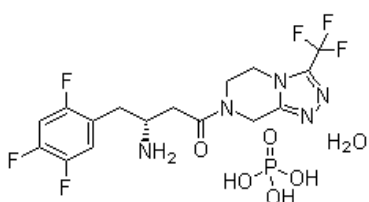
产品编号：MB1496

质量标准：≥98.5%,BR,可用于细胞培养

包装规格：100MG;1G

产品形式：白色或带白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C16H15F6N5O.H3PO4.H2O	结 构 式	
分子量	523.33		
CAS No.	654671-77-9		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL (191.08 mM)		
	Water 41 mg/mL (78.34 mM)		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介** 西他列汀磷酸盐一水合物 Sitagliptin(MK 0431)是 DPP4 高效抑制剂 在 Caco-2 细胞中 IC50 值为 19nM。

**别名**：MK-0431；Januvia；Tesavel；MK-0431 phosphate monohydrate；

7-[(3R)-3-Amino-1-oxo-4-(2,4,5-trifluorophenyl)butyl]-5,6,7,8-tetrahydro-3-(trifluoromethyl)-1,2,4-triazolo[4,3-a]pyrazine phosphate monohydrate

### 物理性状及指标：

外观：.....白色或带白色结晶性粉末

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL (191.08 mM)；Water 41 mg/mL (78.34 mM)；Ethanol Insoluble

含量：.....≥98.5%,BR

**储存条件**：常温，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

特性	Sitagliptin phosphate 是一种有效的 DPP-4 口服抑制剂。
靶点	DPP-4 (Cell-free assay) 19 nM
体外研究	作为一种口服活性剂, Sitagliptin phosphate 对来自 Caco-2 细胞提取物的 DPP-4 有很好抑制效果, IC50 为 19 nM。MK0431 在体外通过一种包括 cAMP/PKA/Rac1 激活在内的通路来减少孤立脾脏 CD4 T 细胞迁移。最近的一项研究表明 sitagliptin 可以直接刺激小肠 L 细胞分泌 GLP-1，这一作用途径不依赖 DPP-4 只依赖蛋白激酶 A 和 MEK-ERK1/2 因此降低了自身对移植存活的影响
体内研究	对自由饲养大鼠的体内研究表明 Sitagliptin phosphate 抑制血浆 DPP-4 活性的 ED50 值药后 7 小时为 2.3 mg/kg 药后 24 小时为 30 mg/kg。Streptozotocin 诱导的 1 型糖尿病小鼠模型中血浆 DPP-4 含量升高, 升高的 DPP-4 可以通过进食 Sitagliptin phosphate 来积极调节高血糖得到大幅抑制, 该过程可能通过延长胰岛移植存活实现。大鼠中血浆清除率和 Sitagliptin phosphate 分配量(40-48 mL/分钟/kg, 7-9 L/kg)比狗(9 mL/分钟/kg, 3 L/kg)高, 在大鼠中半衰期较短为 2 小时, 在狗中半衰期 4 小时。

### 美仑相关产品推荐

MB1496-S	Sitagliptin phosphate monohydrate (标准品)
----------	---

MB21291	磷酸西他列汀-d4
---------	-----------

**用途及描述** 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。本药为二肽基肽酶-4(DPP-4) 抑制药, 通过保护内源性肠降血糖素和增强其作用而控制血糖水平。本药选择性抑制 DPP-4, 对 DPP-8 或 DPP-9 无抑制活性。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9109 mL	9.5544 mL	19.1088 mL
5 mM	0.3822 mL	1.9109 mL	3.8218 mL
10 mM	0.1911 mL	0.9554 mL	1.9109 mL
50 mM	0.0382 mL	0.1911 mL	0.3822 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

激酶实验	<p>血浆 DPP-4 活性分析: DPP-4 从 Caco-2 细胞中提取出来。细胞与裂解缓冲液 (10 mM Tris-HCl, 150 mM NaCl, 0.04 U/ml 抑肽酶, 0.5% Nonidet P40, pH 8.0) 室温孵育 5 分钟, 4°C 条件下 35,000 g 离心 30 分钟将上清储存在 -80°C。将 20 μL 适当浓度的药物稀释液与 50 μL DPP-4 酶底物 H-Ala-Pro-7-amido-4-trifluoromethylcoumarin (终浓度 100 μM) 以及 30 μL Caco-2 细胞提取液 (用 100 mM Tris-HCl, 100 mM NaCl, pH 7.8 稀释 1000 倍) 混合。室温孵育 1 小时, 利用 SpectraMax GeminiXS 在激发/发射波长 405/535 nm 处检测荧光强度。经过 Caco-2 细胞提取液与 DPP-4 酶高浓度抑制剂 (30 nM 对于 BI 1356, 3 μM 对于 vildagliptin) 预孵育 1 小时后来分析抑制剂的解离动力学。将上述预孵育混合物用分析缓冲液稀释 3000 倍加入底物 H-Ala-Pro-7-amido-4-trifluoromethylcoumarin 来起始酶活反应。在这种条件下, DPP-4 在有/无抑制剂存在情况下某一时间点活性的差异反应的是 DPP-4 上结合的抑制剂的数量。利用 SpectraMax 的 SoftMax 软件计算 10 分钟间隔内最大反应速率 (荧光单位/秒 × 1000) 然后纠正反应的未抑制率 <math>[(v_{control} - v_{inhibitor}) / v_{control}]</math>。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: CD4 T 细胞 Concentrations: 100 μM Incubation Time: 1 小时 Method: CD4T 细胞铺在插入无血清 RPMI 1640 培养基中的膜上, 在体外纯化的猪肾脏 DPP-4 (32.1 单位/mg; 100 mU/ml 终浓度) 以及它的抑制剂 (100 μM) 存在或缺少情况下利用通透性隔离腔 (Corning) 分析细胞迁移情况。1 小时后去掉上表面细胞, 对迁移到下面隔离腔的细胞进行计数。然后将迁移幅度与对照组进行比较。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 自由饲养的 Han-Wistar 大鼠 Formulation: 0.5% hydroxyethylcellulose 水溶液 Dosages: ≤ 10 mg/kg Administration: 口服</p>

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

## 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。