

Linagliptin(BI-1356) ; Linagliptin

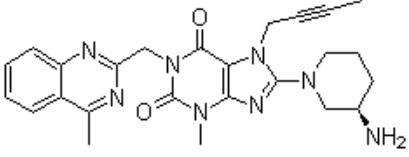
产品编号：MB3462

质量标准：>99%,二肽酶-4(DPP-4)抑制剂

包装规格：100MG;1G

产品形式：powder

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₈ N ₈ O ₂	结构式	
分子量	472.54		
CAS No.	668270-12-0		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 17 mg/mL (35.97 mM) Water : Insoluble Ethanol : 1 mg/mL (2.11 mM)		
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：利拉利汀 Linagliptin 是一种有效的，选择性的 DPP-4 抑制剂，IC₅₀ 值为 1 nM。

别名：BI 1356 ; Linagliptin ; 1H-Purine-2,6-dione,

8-[(3R)-3-amino-1-piperidinyl]-7-(2-butyn-1-yl)-3,7-dihydro-3-methyl-1-[(4-methyl-2-quinazoliny)methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 17 mg/mL (35.97 mM);Water : Insoluble;Ethanol : 1 mg/mL (2.11 mM)

含量：.....>99%

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Linagliptin 是一种高效的，选择性的 DPP-4 抑制剂，IC ₅₀ 为 1 nM。对 DPP-4 的选择性比其他二肽基肽酶类如 DPP-2、DPP-8 和 DPP9 高 10,000 倍以上。
靶点	DPP-4 (cell-free assay) 1 nM
体外研究	在体外，Linagliptin 对 DPP-4 表现出有效的抑制作用，对 hERG 通道和 M1 受体(IC ₅₀ 295 nM) 具有低亲和力。在体外，Linagliptin 以竞争性抑制剂发挥作用，K _i 为 1 nM，对 DPP-4 的选择性比 对 DPP-8，DPP-9，氨基肽酶 N 和 P，脯氨酰寡肽酶，胰蛋白酶，纤溶酶，和凝血酶高 10,000 倍， 比对成纤维细胞活化蛋白高 90 倍。
体内研究	在雄性 Wistar 大鼠，比格犬，和恒河猴中，Linagliptin 对 DPP-4 表现出高效，持久，且有效的抑 制活性，以 1 mg/kg 的剂量口服给药，对所有物种能够达到 70%以上的抑制。口服葡萄糖耐量测试 45 分钟前，Linagliptin 对 db/db 小鼠口服给药，剂量依赖性使血糖波动从 0.1 mg/kg (15% 抑制)

减少到 1 mg/kg (66%抑制)。通过抑制 DPP-4 活性, Linagliptin 降低促炎性标志物换氧合酶-2 和巨噬细胞炎性蛋白-2 的表达, 并增强 ob/ob 小鼠愈合伤口时肌成纤维细胞的形成。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3850	特力利汀;氢溴酸替格列汀
--------	--------------

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。利拉利汀 Linagliptin 是一种有效的, 选择性的 DPP-4 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1162 mL	10.5811 mL	21.1622 mL
5 mM	0.4232 mL	2.1162 mL	4.2324 mL
10 mM	0.2116 mL	1.0581 mL	2.1162 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验 :	Animal Models: 雄性 db/db 小鼠 Formulation: Linagliptin 在 0.1 N HCl 中溶解, 然后在 0.5%含水的羟乙基纤维素溶液(终 HCl 浓度为 3 mM)中稀释。 Dosages: ≤1 mg/kg Administration: 通过口服给药
---------------	--

【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。