

Teneligliptin HBr ; 特力利汀 ; 氢溴酸替格列汀

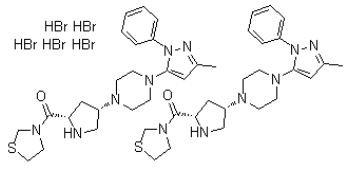
产品编号 : MB3850

质量标准 : >98%,长效 DPP-4 高活性抑制剂

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

| | | | |
|-----------|--|-------------|--|
| 分子式 | 2(C ₂₂ H ₃₀ N ₆ O ₅).5(HBr) | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 1257.72 | | |
| CAS No. | 906093-29-6 | | |
| 储存条件 | -20℃, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性(25°C) | DMSO : 100 mg/mL (159.01 mM) | | |
| | Water : 100 mg/mL (159.01 mM) | | |
| | Ethanol : 17 mg/mL (27.03 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 : Teneligliptin 是新型长效 DPP-4 高活性抑制剂, 竞争性抑制人和大鼠血浆中 DPP-4 及人重组型 DPP-4。本品为溴化氢形式的 Teneligliptin。

别名 : Teneligliptin Hydrobromide (2:5); Teneligliptin HBr ; 替格列汀; 氢溴酸特力利汀; 氢溴酸特力利汀

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (159.01 mM) ; Water : 100 mg/mL (159.01 mM) ; Ethanol : 17 mg/mL (27.03 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | |
|-------------|--|-------|
| 产品描述 | Teneligliptin 是一种新型的、有效的、长效的 dipeptidyl peptidase-4(DPP4)抑制剂。在体外, teneligliptin 竞争性地抑制人血浆、大鼠血浆以及人源重组 DPP4, IC ₅₀ 约为 1 nM。 | |
| 靶点 | DPP-4 | DPP-9 |

| | | |
|-------------|--|--------|
| | 1.75 nM | 150 nM |
| 体外研究 | 对 HUVECs 进行长期 teneligliptin 的处理 (浓度范围 0.1-3 $\mu\text{mol/L}$), teneligliptin 并不降低其细胞活力, 而是减少高血糖状态下 HUVEC 的 HG-stress 标记、增加血红素氧化酶 1 (HMOX1) 的基因表达。长期处理还可改善 HUVEC 细胞的增殖能力以及在高糖状态下 HUVEC 细胞的内质网功能。Teneligliptin 在具有正常葡萄糖浓度的 HUVECs 中具有抗氧化特性, 降低 ROS 水平、启动抗氧化基因的转录级联反应。 | |
| 体内研究 | Teneligliptin 对绝经后肥胖小鼠模型具有减轻体重增加、脂肪积累、降低血清胰岛素和甘油三酸酯水平的作用。还可改善其葡萄糖耐受不良, 但不影响其胰岛素敏感度。Teneligliptin 在绝经后肥胖小鼠中减轻性腺周围脂肪和肝性脂肪变性的慢性炎症, 增强其在夜间的运动活性和能量消耗。Teneligliptin 通过激活 AMPK、下调脂肪生成相关基因的表达来减少肝脏脂肪生成。 | |

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)

| | |
|--------|-----------------------|
| MB3462 | Linagliptin |
| MB0765 | Gemigliptin |
| MB2139 | Omarigliptin(MK-3102) |

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。本品 Teneligliptin 是新型长效 DPP-4 高活性抑制剂, 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 | 1.5902 mL | 7.9509 mL | 15.9018 mL |
| 5 mM | 0.3180 mL | 1.5902 mL | 3.1804 mL |
| 10 mM | 0.1590 mL | 0.7951 mL | 1.5902 mL |
| 50 mM | 0.0318 mL | 0.1590 mL | 0.3180 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|--------------|---|
| 细胞实验: | <p>Cell lines: 人脐静脉内皮细胞(HUVECs)</p> <p>Concentrations: 0.1, 1.0 或 3.0 $\mu\text{mol/L}$</p> <p>Incubation Time: 21 天</p> <p>Method: 接种好 HUVECs 后, 过夜培养使其贴壁。第二天, 将细胞分别暴露于三种葡萄糖实验条件, 加入或者不加入 teneligliptin(0.1, 1.0 或 3.0 $\mu\text{mol/L}$)或 sitagliptin(0.5 $\mu\text{mol/L}$): 连续正常浓度葡萄糖 (NG-5 mmol/L) 21 天; 连续高浓度葡萄糖</p> |
|--------------|---|

| | |
|--------------|---|
| | (HG-25 mmol/L) 21 天；高浓度-代谢记忆 (连续高浓度葡萄糖处理 14 天，然后正常浓度处理 7 天)。每 48 小时更换一次新鲜培养基，期间不将细胞进行传代。 |
| 动物实验： | Animal Models: C57BL6/J 小鼠 Formulation: 水 Dosages: 60 mg/kg Administration: 口服 |

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。