

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	T13809
产品名称:	氢溴酸替格列汀水合物 (特力利汀)

产品简介:

一种有效的 DPP-4 抑制剂, 竞争性抑制人血浆、大鼠血浆和重组人 DPP-4 的活性, IC50 值约为 1 nM。			
靶点:	TLR4	NLRP3 inflammasome	DPP-4
体外研究:			
<p>Teneligliptin (2.5-5 μM, 24 h) hydrobromide hydrate 通过增加 AMPK 的磷酸化防止高糖处理的原代小鼠心肌细胞中 NLRP3 炎症小体激活和损伤。</p> <p>Teneligliptin (1-3 μM, 12 h) hydrobromide hydrate 可抑制活性氧 (ROS) 的产生, 保护大鼠心脏微血管内皮细胞免受缺氧/再给予氧诱导的内皮细胞损伤。</p> <p>Teneligliptin (1.5-3 μM, 24 h) hydrobromide hydrate 可预防 Doxorubicin 诱导的 H9c2 细胞炎症 (细胞因子, 包括 MCP-1 和 IL-1β) 和凋亡 (Bax/Bcl-2 比率的改善)。</p> <p>Teneligliptin (2.5-5 μM, 2-48 h) hydrobromide hydrate 通过抑制骨髓细胞中的 TLR4 和 JNK/AP1/NF-κB 信号传导, 抑制 Lipopolysaccharide 诱导的细胞毒性和炎症反应, 同时降低氧化应激反应。</p> <p>Teneligliptin (3 μM, 3 h) hydrobromide hydrate 通过抑制 p38MAPK 防止高糖和 H2O2 诱导的 USP22-SIRT1 下调, 并抑制高糖诱导的 INS-1 细胞线粒体功能障碍、β 细胞凋亡以及胰岛素分泌减少。</p> <p>Teneligliptin (3 μM, 3 h) hydrobromide hydrate 通过激活 SIRT1 抑制人 1.1b4 β 细胞中高血糖诱导的线粒体功能障碍。</p>			
体内研究:			
<p>Teneligliptin (10 mg/kg, 口服, 24 周) hydrobromide hydrate 改善自发性 2 型糖尿病大鼠糖尿病性多发性神经病变, 增加胰腺 β 细胞体积密度 (Vβ)、胰岛素分泌, 从而抑制葡萄糖刺激后的血糖升高。</p> <p>Teneligliptin (30 mg/kg, 口服, 4 周) hydrobromide hydrate 通过抑制 NLRP3 炎症小体激活减轻 STZ 诱导的糖尿病心肌病小鼠心肌肥大、损伤和相关的炎症反应。</p> <p>Teneligliptin (30-60 mg/kg, 饮水, 10 周) hydrobromide hydrate 在高脂饮食诱发的肥胖小鼠模型中, 通过增加能量消耗来预防肥胖和肥胖相关表现 (抑制脂肪细胞肥大和肝脏脂肪变性)。</p> <p>Teneligliptin (0.1-1 mg/kg, 口服) hydrobromide hydrate 在大鼠和猴子体内具有良好的药代动力学特征。</p> <p>口服 Teneligliptin hydrobromide hydrate 的药代动力学特性。</p>			

使用方法 (供参考):

一: 体外实验	
Water: \geq 100 mg/mL (234.42 mM)	
<1mg/ml 表示微溶或不溶。	
普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。	
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。	
三、细胞实验	
Western Blot Analysis	
Cell Line:	Primary mouse cardiomyocytes treated with high glucose (30 mmol/L)



Concentration:	2.5, 5 μ M
Incubation Time:	24 h
Result:	Inhibited NLRP3 and caspase-1 at 2.5 and 5 μ M. Increased the p-AMPK.
Western Blot Analysis	
Cell Line:	Cardiac microvascular endothelial cells isolated from 1- to 4-day-old SD rats
Concentration:	1, 3 μ M
Incubation Time:	12 h
Result:	Suppressed reactive oxygen species (ROS) and the vascular adhesion molecule ICAM-1. Suppressed transcriptional factor Egr-1 expression.
Western Blot Analysis	
Cell Line:	Human dental pulp cell
Concentration:	2.5, 5 μ M
Incubation Time:	24 h
Result:	Suppressed c-Jun and c-Fos expression Suppressed nuclear p65 protein accumulation

四、动物实验	
Animal Model:	Diabetic cardiomyopathy (55 mg/kg STZ was administered to C57BL/6 male mice by intraperitoneal injection for 5 consecutive days, fasting blood glucose level was higher than 16.7 mmol/L)
Dosage:	30 mg/kg
Administration:	Oral gavage (p. o.), 4 weeks
Result:	Ameliorated myocardial hypertrophy. Improved heart function, with increasing the fractional shortening to 49.6%. Reduced the expression of myocardial injury indicators (CK-MB, AST, LDH). Reduced the critical pathological factor NOX4. Reduced activation of the NLRP3 inflammasome and IL-1 β in the heart.

注意事项:

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20 $^{\circ}$ C

