



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Teneligliptin**
CAS 号: **760937-92-6**
产品货号: **S86434**

生物活性:

Description	Teneligliptin (MP-513) hydrobromide hydrate 是一种口服活性的和选择性的 二肽基肽酶 4 (DPP-4) 抑制剂 (对人和大鼠酶的 IC50s 分别为 0.37 和 0.29 nM)。Teneligliptin hydrobromide hydrate 可改善血糖水平, 可用于 2 型糖尿病相关的研究。	
IC50 & Target	DPP-4	
In Vitro	Teneligliptin (2.5-5 μ M, 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[3]。	
	Teneligliptin (1-3 μ M, 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[5]。	
	Teneligliptin (1.5-3 μ M, 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-1 β) 和凋亡 (Apoptosis) (Bax/Bcl-2 比率的改善)[6]。	
	Teneligliptin (2.5-5 μ M, 2-48 h) hydrobromide hydrate 通过抑制骨髓细胞中的 TLR4 和 JNK/AP1/NF- κ B 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[7]。	
	Teneligliptin (3 μ M, 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[8]。	
	Teneligliptin (3 μ M, 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[8]。	
	Western Blot Analysis[3]	
	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[5]	
	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[7]	
	Cell Line:	Human dental pulp cells
	Concentration:	2.5, 5 μ M
	Incubation Time:	24 h
	Result:	Suppressed c-Jun and c-Fos expression Suppressed nuclear p65 protein accumulation



In Vivo	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 (V_{β})、胰岛素分泌, 从而抑制葡萄糖刺激后的血糖升高[2]。 Teneligliptin (30 mg/kg, 口服, 4 周) hydrobromide hydrate 通过抑制 NLRP3 炎性小体激活减轻 STZ (HY-13753) 诱导的糖尿病心脏病小鼠心肌肥大、损伤和相关的炎症反应[3]。 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)[4]。 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[1]。			
	Animal Model:	Diabetic cardiomyopathy (55 mg/kg STZ (HY-13753) 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)[3]		
	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.		

Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (78.13 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3442 mL	11.7211 mL	23.4423 mL
		5 mM	0.4688 mL	2.3442 mL	4.6885 mL
		10 mM	0.2344 mL	1.1721 mL	2.3442 mL
*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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					



	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Yoshida T, et al. Discovery and preclinical profile of teneligliptin (3-[(2S,4S)-4-[4-(3-methyl-1-phenyl-1H-pyrazol-5-yl)piperazin-1-yl]pyrrolidin-2-ylcarbonyl]thiazolidine): a highly potent, selective, long-lasting and orally active dipeptidyl peptidase IV inhibitor for the treatment of type 2 diabetes. Bioorg Med Chem. 2012 Oct 1;20(19):5705-19. [2]. Guo D, et al. Beneficial effects of combination therapy of canagliflozin and teneligliptin on diabetic polyneuropathy and β-cell volume density in spontaneously type 2 diabetic Goto-Kakizaki rats. Metabolism. 2020 Jun;107:154232. [3]. Zhang GL, et al. Teneligliptin mitigates diabetic cardiomyopathy by inhibiting activation of the NLRP3 inflammasome. World J Diabetes. 2024 Apr 15;15(4):724-734. [4]. Fukuda-Tsuru S, et al. The novel dipeptidyl peptidase-4 inhibitor teneligliptin prevents high-fat diet-induced obesity accompanied with increased energy expenditure in mice. Eur J Pharmacol. 2014 Jan 15;723:207-15. [5]. Zhang Z, et al. Teneligliptin protects against hypoxia/reoxygenation-induced endothelial cell injury. Biomed Pharmacother. 2019 Jan;109:468-474. [6]. Peng W, et al. Teneligliptin prevents doxorubicin-induced inflammation and apoptosis in H9c2 cells. Arch Biochem Biophys. 2020 Apr 15;683:108238. [7]. Liu X, et al. Teneligliptin inhibits lipopolysaccharide-induced cytotoxicity and inflammation in dental pulp cells. Int Immunopharmacol. 2019 Aug;73:57-63. [8]. Elumalai S, et al. High glucose-induced PRDX3 acetylation contributes to glucotoxicity in pancreatic β-cells: Prevention by Teneligliptin. Free Radic Biol Med. 2020 Nov 20;160:618-629.
完整储备液配制表: 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。	



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year. -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	浓度				
DMSO	1 mM	2.3442 mL	11.7211 mL	23.4423 mL	58.6057 mL
	5 mM	0.4688 mL	2.3442 mL	4.6885 mL	11.7211 mL
	10 mM	0.2344 mL	1.1721 mL	2.3442 mL	5.8606 mL
	15 mM	0.1563 mL	0.7814 mL	1.5628 mL	3.9070 mL
	20 mM	0.1172 mL	0.5861 mL	1.1721 mL	2.9303 mL
	25 mM	0.0938 mL	0.4688 mL	0.9377 mL	2.3442 mL
	30 mM	0.0781 mL	0.3907 mL	0.7814 mL	1.9535 mL
	40 mM	0.0586 mL	0.2930 mL	0.5861 mL	1.4651 mL
	50 mM	0.0469 mL	0.2344 mL	0.4688 mL	1.1721 mL
	60 mM	0.0391 mL	0.1954 mL	0.3907 mL	0.9768 mL

源叶