

## Rosiglitazone 罗格列酮

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53259ES25	25 mg
Rosiglitazone 罗格列酮	53259ES60	100 mg
	53259ES70	200 mg

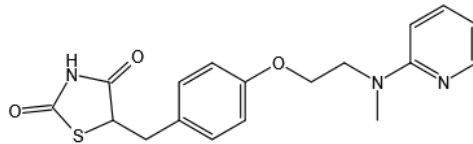
### 产品描述

Rosiglitazone (BRL 49653, BRL49653), 也称罗格列酮, 是噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂, 是选择性的, 具有口服活性的 PPAR $\gamma$  激动剂, 对 PPAR $\gamma$ 1、PPAR $\gamma$ 2 和 PPAR $\gamma$  的 EC<sub>50</sub> 值分别为 30 nM、100 nM 和 60 nM。Rosiglitazone 与 PPAR $\gamma$  结合, K<sub>d</sub> 约为 40 nM。Rosiglitazone 也是 TRPC5 的激活剂 (EC<sub>50</sub>=30  $\mu$ M) 和 TRPM3 的抑制剂。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Rosiglitazone, BRL 49653, BRL49653
中文名称 (Chinese Name)	罗格列酮
靶点 (Target)	PPAR $\gamma$
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage
CAS 号 (CAS NO.)	122320-73-4
分子式 (Formula)	C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S
分子量 (Molecular Weight)	357.43
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C, 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

### 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. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

### 使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

### (一) 细胞实验 (体外实验)

罗格列酮(0.1-10 $\mu$ M)促进 C3H10T1/2 干细胞分化为脂肪细胞。<sup>[1]</sup> 罗格列酮(1 $\mu$ M)可以保护 Neuro2A 细胞和海马神经元免受氧化应激,并以 NF- $\alpha$ 1 依赖性方式上调 BCL-2 的表达。<sup>[3]</sup> 罗格列酮完全抑制硝苯地平和 PregS 诱发的 TRPM3 活性, IC<sub>50</sub> 值为 9.5  $\mu$ M 和 4.6  $\mu$ M,但这种效应不是通过 PPAR $\gamma$ 。罗格列酮在较高浓度下抑制 TRPM2, IC<sub>50</sub> 为 22.5 $\mu$ M。<sup>[4]</sup>

### (二) 动物实验 (体内实验)

在糖尿病大鼠模型中,口服罗格列酮 (5 mg/kg)表现出对乙酰胆碱诱导的舒张作用的增强以及对 Ang II 和去氧肾上腺素刺激的糖尿病主动脉收缩的拮抗作用,并且显著改善血糖、血管粘附分子-1、IL-6 和 TNF- $\alpha$ 水平以及主动脉氧化剂/抗氧化剂平衡。<sup>[5]</sup>

### 参考文献

- [1]. Lehmann JM, et al. An antidiabetic thiazolidinedione is a high affinity ligand for peroxisome proliferator-activated receptor gamma (PPAR gamma). J Biol Chem. 1995 Jun 2;270(22):12953-6.
- [2]. Willson TM, et al. The structure-activity relationship between peroxisome proliferator-activated receptor gamma agonism and the antihyperglycemic activity of thiazolidinediones. J Med Chem. 1996 Feb 2;39(3):665-8.
- [3]. Thouennon E, et al. Rosiglitazone-activated PPAR $\gamma$  induces neurotrophic factor- $\alpha$ 1 transcription contributing to neuroprotection. J Neurochem. 2015 Aug;134(3):463-70.
- [4]. Majeed Y, et al. Rapid and contrasting effects of rosiglitazone on transient receptor potential TRPM3 and TRPC5 channels. Mol Pharmacol. 2011 Jun;79(6):1023-30.
- [5]. Ateyya H, et al. Beneficial effects of rosiglitazone and losartan combination in diabetic rats. Can J Physiol Pharmacol. 2018 Mar;96(3):215-220.