

Telmisartan ; 替米沙坦

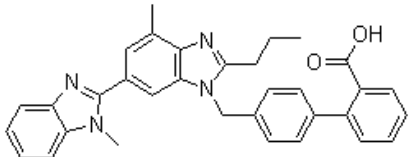
产品编号：MB1500

质量标准：>99%,可用于细胞培养

包装规格：1G;5G

产品形式：白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C33H30N4O2	结构式	
分子量	514.62		
CAS No.	144701-48-4		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 13 mg/mL (25.26 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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 替米沙坦 Telmisartan 是一种有效的血管紧张素 II 1 型受体 (angiotensin II type 1 receptor) 拮抗剂，能够抑制其活性， IC_{50} 值为 9.2 nM。

别名：BIBR 277; Telmisartan ; 4'[(1,4'-Dimethyl-2'-propyl[2,6'-bi-1H-benzimidazol]-1'-yl)methyl][1,1'-biphenyl]-2-carboxylic acid

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色结晶性粉末

熔点：.....261-263 °C

溶解性：.....DMSO : 13 mg/mL (25.26 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

密度：.....~1.2 g/cm³ (预测)

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....>99%,可用于细胞培养

IC_{50} ：.....AT2: IC_{50} = 0.33 nM (人); AT1: IC_{50} = 0.49 nM (人);

.....Type-1B angiotensin II receptor: IC_{50} = 3 nM (大鼠);

.....PPAR γ : EC_{50} = 1.52 μ M ; Plasmodium berghei: IC_{50} = 25 nM;

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Telmisartan 是一种血管紧张素 II 受体拮抗剂 (ARB)，用于治疗高血压。
靶点	angiotensin II receptor
体外研究	Telmisartan 是适度有效的 (EC_{50} = 4.5 微米)，选择性 PPAR γ 部分激动剂，激活受体达到完全激动剂 pioglitazone 和 rosiglitazone 的最高水平的 25%到 30%。Telmisartan 诱导 3T3-L1 细胞的脂肪分化。Telmisartan 导致小鼠肌肉肌管中的 ACC2 的表达减少的 60%至 70%。Telmisartan，但不是 candesartan (另一 ARB)，以剂量依赖的方式下调 RAGE mRNA 水平。Telmisartan 在

	Hep3B 细胞中降低基底以及 AGE 诱导 RAGE 蛋白的表达。在 Hep3B 细胞中，Telmisartan 剂量依赖性抑制 AGE 诱导 ROS 产生和随后诱导 CRP 基因和蛋白的表达。Telmisartan 有效地促进 3T3-L1 前脂肪细胞的分化。在正在分化和完全分化的脂肪细胞中，Telmisartan 剂量依赖性增加 mRNA 水平，如 PPARgamma 靶基因 AP2 和脂连蛋白。在分化脂肪细胞中，Telmisartan 减弱 1 型 11beta 羟脱氢酶的 mRNA 水平。
体内研究	在高脂肪，高碳水化合物饮食喂养的大鼠中，Telmisartan 促进增加热量的消耗和防止饮食诱导的体重增加。在高脂肪，高碳水化合物喂养的小鼠中，Telmisartan 减少内脏脂肪的积聚和降低脂肪细胞大小，比 valsartan 程度大得多，并且还显著减少的肝甘油三酯水平相关联。

美仑相关产品推荐

MB1500-S	替米沙坦 (标准品)
----------	------------

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。替米沙坦是一种口服起效的，特异性血管紧张素 II 受体 (AT1 型) 拮抗剂，与血管紧张素 II 受体 AT1 亚型 (已知的血管紧张素 II 作用位点) 呈高亲和性结合，该结合作用持久，但无任何部分激动剂效应。由于替米沙坦导致血管紧张素 II 水平增高，从而可能引起的受体过度刺激效应亦不可知。替米沙坦可致醛固酮水平下降。替米沙坦不抑制人体血浆肾素，亦不阻断离子通道。血管紧张素转换酶 (激酶 II) 亦可降解缓激肽，由于替米沙坦不抑制血管紧张素转换酶，故不会出现缓激肽作用增强导致的不良反应。替米沙坦对其他受体 (包括 AT2 和其它特征更少的 AT 受体，功能尚不清楚) 无亲和力。

储液配置

体 积 浓度	质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.9432 mL	9.7159 mL	19.4318 mL
5 mM		0.3886 mL	1.9432 mL	3.8864 mL
10 mM		0.1943 mL	0.9716 mL	1.9432 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	Telmisartan 是在 DMSO 中作为 10mm 的库存溶液制备的。细胞增殖通过 CCK-8 细胞计数试剂盒检测。短暂的 5 10 ³ 个细胞被播种到每一个 96 孔板和 100 年培养 μL rpmi - 1640 补充 10% 的边后。24 小时后, ARBs 药物(替米沙坦、irbesartan 洛沙坦、缬沙坦(0,1,10 或 100 μM)或车辆被添加到每个好, 和一个额外的细胞培养 48 h。CCK-8 试剂(10 μL)是添加到每个盘子是孵化在 37 C 3 h。450 nm 的吸光度测量使用标。
动物实验	替米沙坦用 DMSO 配制。 使用层流气流架将雄性无胸腺小鼠 (BALB / c-nu / nu; 6 周龄; 20-25g) 维持在没有特定病原体的条件下。小鼠可连续自由进入灭菌 (γ-辐射) 食物和高压灭菌水。每只小鼠在侧腹皮下接种 OE19 细胞 (每只动物 5 × 10 ⁶ 个细胞)。一周后, 异种移植瘤可识别为最大直径 > 4mm 的肿块。将动物随机分配给替米沙坦 (每天 50 μg) 或仅用稀释剂 (对照) 治疗。替米沙坦组腹腔注射 (i.p.), 每周注射 5 次, 每次 2mg / kg 替米沙坦, 持续 4 周; 对照组单独给予 5% DMSO, 持续 4 周。每天由相同的研究者监测肿瘤生长, 并且每周测量肿瘤大小。肿瘤体积 (mm ³) 计算为肿瘤长度 (mm) × 肿瘤宽度 (mm) / 2。处理后第 22 天处死所有动物, 并且在此期间所有动物都存活。通过双向 ANOVA 分析肿瘤生长的组间差异。

【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。