

## Tiotropium bromide anhydrous; 噻托溴铵

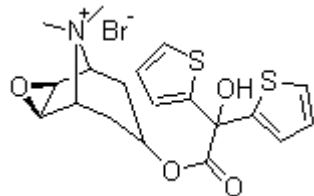
产品编号: MB1680

质量标准: >97%,BR,无水物

包装规格: 100MG; 1G; 5G

产品形式: 白色或类白色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C19H22BrNO4S2	结构式	
分子量	472.41		
CAS No.	136310-93-5		
储存条件	2-8℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO 8 mg/mL (16.31 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:** 噻托溴铵 Tiotropium 溴化物是 毒蕈碱乙酰胆碱受体 (mAChR) 拮抗剂, 可阻断乙酰胆碱配体的结合。

**别名:** Tiotropium; 3-Oxa-9-azoniatricyclo[3.3.1.0<sup>2,4</sup>]nonane,

7-[(2-hydroxy-2,2-di-2-thienylacetyl)oxy]-9,9-dimethyl-, bromide (1:1), (1 $\alpha$ ,2 $\beta$ ,4 $\beta$ ,5 $\alpha$ ,7 $\beta$ )-

**物理性状及指标:**

外观: .....白色或类白色结晶性粉末

熔点: .....218~220℃

溶解性: .....DMSO 8 mg/mL (16.31 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量: .....>97%

**储存条件:** 2-8℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	Tiotropium Bromide hydrate 是 Tiotropium bromide (Spiriva; Tiova; BA 679BR; Tiotropium)的一水合物, 是抗胆碱药, 支气管扩张剂及毒蕈碱受体拮抗剂。
靶点	AChR
体外研究	在豚鼠和人的气道中, Tiotropium bromide 具有抗胆碱能神经引起的收缩的作用, 起效比 atropine 或 ipratropium bromide 慢。Tiotropium bromide, ipratropium bromide 和 atropine 都增加神经刺激的乙酰胆碱的释放, 该三拮抗剂的效果被同样迅速地洗掉。Tiotropium bromide 慢慢地从 M3 受体 (上气道平滑肌) 解离, 而迅速地 M2 的自身受体 (胆碱能神经末梢) 解离。Tiotropium bromide 显著抑制 AM, MonoMac6 和 A549 细胞释放趋化物质。Tiotropium bromide 抑制从 PBMC 中产生 Th2 型细胞因子。
体内研究	在急性和慢性哮喘小鼠模型中, Tiotropium bromide 显著降低支气管肺灌洗液 (BALF) 中

的气道炎症和 Th2 型细胞因子产生。在哮喘的小鼠模型中，Tiotropium bromide 显著降低了杯状细胞转化，气道平滑肌的厚度，和气道纤维化。Tiotropium bromide 减少慢性模型中转化生长因子-β1 在支气管肺泡灌洗液的水平。在过敏性哮喘的豚鼠模型中，Tiotropium bromide 抑制在正在增加的气道平滑肌的质量，肌球蛋白的表达，并收缩。在慢性阻塞性肺疾病(COPD)的豚鼠模型中，Tiotropium bromide 废除 LPS 诱导的中性粒细胞，杯状细胞，胶原沉积和 muscularised 微血管的增加，但对肺气肿没有影响。

#### 美仑相关产品推荐

MB25001	噻托溴铵-d3
---------	---------

**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。噻托溴铵是一个长效、特异性的抗毒蕈碱药物，临床上通常称为抗胆碱能药物。通过与支气管平滑肌上的毒蕈碱受体结合，噻托溴铵抑制由副交感神经末梢释放的乙酰胆碱所导致的胆碱能效应(支气管收缩)。噻托溴铵对毒蕈碱受体亚型 M1~M5 有相似的亲和力。在呼吸道中，噻托溴铵竞争性地、可逆地拮抗 M3 受体导致平滑肌松弛。支气管扩张作用呈剂量依赖性，并可持续 24 小时以上。作用时间长可能是由于其与 M3 受体解离非常慢，其解离半衰期显著长于异丙托溴铵。作为四价铵抗胆碱能药物，噻托溴铵在吸入给药时具有局部(支气管)选择性，由此可达到治疗效果而不至于产生全身性抗胆碱能作用。支气管扩张主要是局部效应(气道)，而非全身性。噻托溴铵与 M2 受体的解离较与 M3 受体解离快，在体外功能性研究中，其对 M3 的受体亚型选择性高于 M2 (动力学控制)。与受体高效结合并缓慢解离的临床相关性体现为噻托溴铵用于 COPD 患者，可产生显著且长效的支气管扩张效应

#### 储液配置

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0390 mL	10.1951 mL	20.3903 mL
5 mM	0.4078 mL	2.0390 mL	4.0781 mL
10 mM	0.2039 mL	1.0195 mL	2.0390 mL
50 mM	-	-	-

#### 【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。如需制备储备液，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。