

## Bosentan hydrate; 波生坦(水合物)

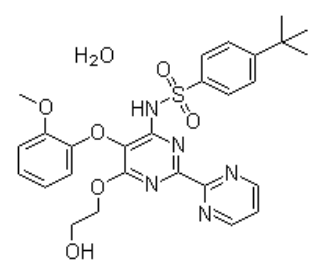
产品编号: MB1772

质量标准: ≥98.5%,BR,一水合物

包装规格: 100MG;1G

产品形式: 白色至黄色粉末

### 基本信息

分子式	C27H29N5O6S.H2O	结构式	
分子量	569.63		
CAS No.	157212-55-0		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 100 mg/mL (175.55 mM)		
	Water: 0.001 mg/mL (0.0 mM)		
	Ethanol: 2 mg/mL (3.51 mM)		
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:** 波生坦水合物 Bosentan hydrate 是一种竞争性的 endothelin-1 (ET) 拮抗剂, 在人 SMC 中, 作用于 ET<sub>A</sub> 和 ET<sub>B</sub> 受体, K<sub>i</sub> 分别为 4.7 nM 和 95 nM。

**别名:** Benzenesulfonamide ;

4-(1,1-Dimethylethyl)-N-(6-(2-hydroxyethoxy)-5-(2-methoxyphenoxy)(2,2'-bipyrimidin)-4-yl)benzenesulfonamide monohydrate

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至黄色粉末

溶解性: .....DMSO 100 mg/mL (175.55 mM); Water: 0.001 mg/mL (0.0 mM); Ethanol: 2 mg/mL (3.51 mM)

含量: .....≥98.5%

**储存条件:** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Bosentan Hydrate 是一种内皮素(ET)受体拮抗剂, 靶点有 <b>ET-A</b> 和 ET-B, K <sub>i</sub> 分别为 4.7 nM 和 95 nM。	
<b>靶点</b>	ET-A 4.7 nM(Ki)	ET-B 95 nM(Ki)
<b>体外研究</b>	Bosentan 竞争性拮抗 <sup>[125I]</sup> 标记的 ET-1 与人平滑肌细胞(ET-A 受体)和人体胎盘素 (ET-B 受体)的特异性结合。Bosentan 还可以抑制选择性的 ET-B 配体与猪气管结合。离体大鼠主动脉(ET-A)中 ET-1 诱导的收缩以及大鼠气管中选择性 ET-B 激动剂 sarafotoxin S6C 诱导的收缩可以被 Bosentan 竞争性抑制(pA2 分别为 7.2 和 6.0), 兔肠系膜上动脉中 sarafotoxin S6C	

	引起的血管内皮依赖性舒张也会被抑制(pA2= 6.7)。其它 40 种多肽, 前列腺素类, 离子以及神经递质没有明显受到 Bosentan 的影响, 这表明了该药物对 ET 受体的特异性。
<b>体内研究</b>	静脉注射和口服 Bosentan 均能抑制大 ET-1 引起的升压反应, 活性时间长而且没有内在的激动剂活性。Bosentan 还可以抑制 ET-1 和 sarafotoxin S6C 的降压和升压效果。药理学特性使得 Bosentan 成为很有潜力的药物可以用于临床血管收缩相关的疾病。Bosentan 是第一个可以口服的非多肽混合 ETA/B 受体拮抗剂。对于充血性心力衰竭 (CHF) 的大鼠用 Bosentan 长期治疗可以显著提高存活率, 改善血液动力学和心脏重塑。Bosentan 可以降低动脉血压, 效果与血管紧张素转化酶 (ACE) 抑制剂相当。Bosentan 处理的急性心肌梗死后的 CHF 大鼠可以降低动脉血压并对 ACE 抑制剂具有累加效果。采用 Bosentan 急性或慢性治疗可以通过降低外周血管和肺血管阻力以及增加心输出量来改善 CHF 病人的全身和肺部的血液动力。

#### 美仑相关产品推荐

MB1772-S	波生坦水合(标准品)
MB25595	波生坦-d4

**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。波生坦可降低肺和全身血管阻力, 从而在不增加心率的情况下增加心脏输出量。神经激素内皮素是一种有力的血管收缩素, 能够促进纤维化、细胞增生和组织重构。在许多心血管失调疾病, 包括肺动脉高压, 血浆和组织的内皮素浓度增加, 表明内皮素在这些疾病中起病理作用。在肺动脉高压, 血浆内皮素浓度与预后不良紧密相关。波生坦是特异性内皮素受体。波生坦与 ETA 和 ETB 受体竞争结合, 与 ETA 受体的亲和力比与 ETB 受体的亲和力稍高。在动物肺动脉高压模型中, 长期口服波生坦能减少肺血管阻力、逆转肺血管和右心室肥大。在动物肺纤维化模型中, 波生坦能减少胶原沉积。

#### 储液配置

体质量 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7555 mL	8.7776 mL	17.5553 mL
5 mM	0.3511 mL	1.7555 mL	3.5111 mL
10 mM	0.1756 mL	0.8778 mL	1.7555 mL
50 mM	0.0351 mL	0.1756 mL	0.3511 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>动物实验</b>	Animal Models: 患有充血性心力衰竭的雄性 Wistar 大鼠 Formulation: 5% 阿拉伯树胶, 每天新鲜配制 Dosages: 30 mg/kg, 100 mg/kg Administration: 口服
-------------	--

#### 【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。