

Aliskiren hemifumarate ; 阿利克仑半富马酸盐

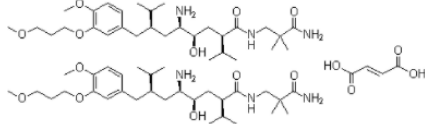
产品编号：MB1819

质量标准：>95%,BR

包装规格：200MG;1G

产品形式：白色或类白色粉末

基本信息

| | | | |
|---------------|--|-----|--|
| 分子式 | 2(C ₃₀ H ₅₃ N ₃ O ₆).C ₄ H ₄ O ₄ | 结构式 |  |
| 分子量 | 1219.60 | | |
| CAS No. | 173334-58-2 | | |
| 储存条件 | 常温，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 100 mg/mL (163.98 mM) Water 100 mg/mL (163.98 mM) Ethanol 100 mg/mL (163.98 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：阿利克仑半富马酸盐 Aliskiren(CGP 60536)半富马酸盐是肾素的直接抑制剂，IC₅₀ 为 1.5 nM。

别名：CGP 60536; CGP60536B; SPP 100 ; Benzeneoctanamide,

δ-amino-N-(3-amino-2,2-dimethyl-3-oxopropyl)-γ-hydroxy-4-methoxy-3-(3-methoxypropoxy)-α,ζ-bis(1-methylethyl)-, (αS,γS,δS,ζS)-, (2E)-2-butenedioate (2:1)

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

溶解度：.....可溶于 DMSO

干燥失重：.....≤0.5%

敏感性：.....对热、光线敏感

纯度：.....>95%,BR

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | | |
|-------------|--|-------|--------|
| 产品描述 | Aliskiren Hemifumarate 是一种直接肾素抑制剂，IC ₅₀ 为 1.5 nM。 | | |
| 靶点 | <table border="1"> <tr> <td>Renin</td> </tr> <tr> <td>1.5 nM</td> </tr> </table> | Renin | 1.5 nM |
| Renin | | | |
| 1.5 nM | | | |
| 体外研究 | Aliskiren hemifumarate 似乎会结合到疏水性 S1/S3-结合口袋和从 S3-结合位点延伸到肾素疏水核的大的，明显的亚口袋。Aliskiren hemifumarate 的口服利用度在大鼠，狨猴和人类中分别为 2.4%，16%和 2.5%。 | | |
| 体内研究 | 在钠耗竭的狨猴体内，Aliskiren hemifumarate (< 10 mg/kg，口服)抑制血浆肾素活性，并降低血压。在轻度至中度高血压患者中，Aliskiren hemifumarate 每天一次口服治疗有效降低血压，并且具有安全性和耐受性。 | | |

美仑相关产品推荐

| | |
|---------|-----------|
| MB2032 | 阿利克仑-5 |
| MB25653 | 盐酸阿利克仑-d6 |

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。阿利克仑为第二代肾素抑制剂，作用于肾素血管紧张素醛固酮系统(RAS)的第一限速步骤。与 ACEI 相比，阿利克仑能更有效地减少血管紧张素 II 生成。临床试验也已证实，阿利克仑与 ARB 联合应用，对 RAS 的抑制有协同作用，并可消除 ARB 致血管紧张素 II 堆积的效应。阿利克仑不产生反射性心动过速，不影响心功能；降压作用为肾素依赖性，因此大剂量给药只会延长作用时间，不会导致血压骤降。与 ARB 相似，阿利克仑不良反应的发生率与安慰剂组相比无明显差异。

储液配置

| 体 浓度 | 质 量 积 | | |
|---------|-------------|-----------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 1.6398 mL | 8.1990 mL | 16.3980 mL |
| 5 mM | 0.3280 mL | 1.6398 mL | 3.2796 mL |
| 10 mM | 0.1640 mL | 0.8199 mL | 1.6398 mL |
| 50 mM | 0.0328 mL | 0.1640 mL | 0.3280 mL |

【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。