

Rivaroxaban ; 利伐沙班

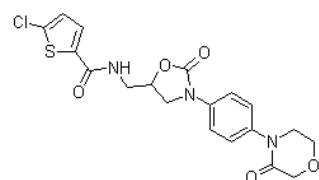
产品编号：MB1878

质量标准：≥98%,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	C19H18ClN3O5S	结构式	
分子量	435.88		
CAS No.	366789-02-8		
储存条件	常温，防潮密闭避光		
溶解性 (25°C)	DMSO : 87 mg/mL (199.59 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：利伐沙班 Rivaroxaban 是一种高效的选择性 **Factor Xa (FXa)** 抑制剂，具有强效抗 FXa 活性 (**IC₅₀** 为 0.7 nM, **K_i** 为 0.4 nM)。

别名：利伐沙班; Rivaroxaban

(S)-5-chloro-N-((2-oxo-3-(4-(3-oxomorpholino)phenyl)oxazolidin-5-yl)methyl)thiophene-2-carboxamide

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

熔点：.....228-229 °C

溶解性：.....DMSO : 87 mg/mL (199.59 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

密度：.....~1.5 g/cm³ (预测)

含量：.....≥98%

IC₅₀ :Factor X: IC₅₀ = 0.7 nM (人); 纯化兔 FXa: IC₅₀ = 0.8 nM;

.....凝血酶原酶活性: IC₅₀ = 2.1 nM; 纯化鼠 FXa: IC₅₀ = 3.4 nM

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Rivaroxaban 是一种 Factor Xa 的直接抑制剂，无细胞试验中 K_i 和 IC₅₀ 分别为 0.4 nM 和 0.7 nM。Rivaroxaban 对人源 factor Xa 具有高选择性，是对其他生物性相关的丝氨酸蛋白酶的选择性的 10 000 倍以上。	
特性	Rivaroxaban 是一种口服具有直接作用的 Factor Xa 抑制剂。	
靶点	Factor Xa (Cell-free assay)	Prothrombinase (Cell-free assay)
	0.7 nM	2.1 nM

体外研究	Rivaroxaban 是一种口服具有直接作用的 Factor Xa (FXa)抑制剂, 对于预防和治疗动静脉血栓生成有作用, K_i 值 0.4 nM, 同时还可以抑制凝血酶原酶活性 IC_{50} 为 2.1 nM. Rivaroxaban 对于纯化的人源和兔源的 FXa 也有类似的亲和性 (IC_{50} 分别为 0.7 nM 和 0.8 nM), 但对于大鼠 FXa 亲和性较差 (IC_{50} 为 3.4 nM)。在血浆中, Rivaroxaban 对人和兔内源 FXa 抑制效果相当 (IC_{50} 均为 21 nM),但在大鼠血浆中要达到同样的抑制效果需要提高 14 倍药物浓度 (IC_{50} 290 nM)。Rivaroxaban 在 Caco-2 细胞中作为 P-gp 底物具有高渗透性和极化运输特性, 在体外直到 100 μ M 仍然对于 P-gp 介导的药物运输没有影响。
体内研究	体内实验中, Rivaroxaban 可以减少大鼠静脉瘀血模型的静脉血栓形成, 这一作用具有剂量依赖特性 (ED_{50} 为 0.1 mg/kg 静脉注射)。Rivaroxaban 在大鼠和兔的动静脉分流模型中会减少动脉血栓形成, ED_{50} 分别为 5.0 mg/kg (口服) 和 0.6 mg/kg (口服)。Rivaroxaban 在研究剂量范围内(大鼠 1-10 mg/kg, 狗 0.3-3 mg/kg)的血浆药代动力学是线性的。血浆清除率比较低: 大鼠 0.4 L/(kg·h), 狗 0.3 L/(kg·h), 分布体积(V(ss))稳定: 大鼠 0.3 L/kg, 狗 0.4 L/kg。在两种物种中口服之后消除半衰期都比较短 (0.9-2.3 hours)。

美仑相关产品推荐

MB1878-S	利伐沙班(标准品)
MB25684	利伐沙班-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。Rivaroxaban 是一种 **Factor Xa** 的直接抑制剂, 对于预防和治疗动静脉血栓生成有作用。

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2942 mL	11.4710 mL	22.9421 mL
5 mM	0.4588 mL	2.2942 mL	4.5884 mL
10 mM	0.2294 mL	1.1471 mL	2.2942 mL
50 mM	0.0459 mL	0.2294 mL	0.4588 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	Factor Xa 活性分析: 在 96 孔板中利用发色的或荧光底物来测量 Rivaroxaban 对纯化的丝氨酸蛋白酶的活性。酶与 Rivaroxaban 或 DMSO 孵育 10 分钟。加入底物起始反应, 利用 Spectra Rainbow Thermo Reader 在 405 nm 或利用 SPECTRAfluor 在 630/465 nm 连续监测荧光 20 分钟。酶活性实验在以下缓冲液中进行(终浓度): 人 FXa (0.5 nM), 兔 FXa (2 nM), 大鼠 FXa (10 nM) 或尿激酶 (4 nM) 溶于 50 mM Tris-HCl 缓冲液 pH 8.3, 150 mM NaCl, 以及 0.1% BSA; Pefachrome FXa (50-800 μ M) 或 chromozym U (250 μ M) 带有凝血酶(0.69 nM), 胰酶 (2.2 nM), 或 血纤维蛋白溶酶(3.2 nM)溶于 0.1 μ M Tris-HCl, pH 8.0 以及 20 mM CaCl ₂ ; chromozym TH (200 μ M), chromozym 胞浆素(500 μ M)或 chromozym 胰酶 (500 μ M) 带有 FXIa (1 nM) 或 APC (10 nM) 溶于 50mM 磷酸盐缓冲液, pH 7.4, 150 mM NaCl; 和 S 2366 (150 或 500 μ M) 带有 FVIIa (1 nM) 以及组织因子(3 nM) 溶于 50 mM Tris-HCl 缓冲液, pH 8.0, 100 mM NaCl, 5 mM CaCl ₂ 和 0.3% BSA, H-D-Phe-Pro-Arg-6-amino-1-naphthalene-benzylsulfonamide-H ₂ O (100 μ M), 测量
--------------	--

	3 小时。FIXa β /FX 分析 (包含 FIXa β (8.8 nM)和 FX (9.5 nM) 溶于 50 mM Tris-HCl 缓冲液, pH 7.4, 100 mM NaCl, 5 mM CaCl ₂ 和 0.1% BSA) 从加入 I-1100 (50 μ M)开始测量 60 分钟。 根据 Cheng-Prusoff 方程计算对 FXa 的抑制常数。IC ₅₀ 是能使对照组反应初速度降低一半所需的抑制剂的量。
细胞实验：	Cell lines: Caco-2, 野生型和 P-gp 过表达的 LLC-PK1 Concentrations: 0 到 100 μ M Incubation Time: 2 小时 Method: LLC-PK1 和 L-MDR1 细胞接种在 96 孔板中并插入微孔聚碳酸酯, 在没有长春新碱的条件下培养 4 天。每隔两天换一次培养基。在分析开始前首先将培养基换成添加有 10 mM HEPES 的 HBSS 缓冲液。需要检测的不同化合物溶于 DMSO 并用转运缓冲液稀释相应的反应终浓度 (保持 DMSO 终浓度始终为 1%)。加入适当浓度抑制剂, 37°C 孵育 2 小时, 样品从每个孔中取出, 加入乙酸铵缓冲液和乙腈然后利用液质联用质谱仪 (LC-MS/MS) 分析。
动物实验：	Animal Models: 雄性禁食的 Wistar 大鼠 (HsdCpb:WU) 以及雌性禁食的新西兰白兔 (Esd:NZW). Formulation: 静脉注射用 Rivaroxaban 溶于聚乙二醇/ H ₂ O /甘油 (996 g/100 g/60 g) 中; 口服用 Rivaroxaban 溶于 solutol/乙醇/H ₂ O [40%/10%/50% (v/v/v)] 中 Dosages: 静脉注射 \leq 0.3 mg/kg 口服 \leq 3 mg/kg Administration: 静脉注射或口服

【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。