

Apixaban ; 阿哌沙班

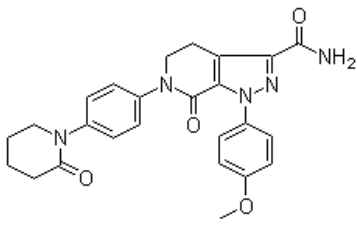
产品编号：MB1879

质量标准：>98.5%,选择性活化X因子抑制剂

包装规格：100MG;1G

产品形式：白色粉末

基本信息

分子式	C25H25N5O4	结构式	
分子量	459.50		
CAS No.	503612-47-3		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 18 mg/mL (39.17 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：阿哌沙班 Apixaban 是一种高度选择性的，可逆的 **Factor Xa** 抑制剂，抑制人和兔的 Factor Xa， K_i 值分别为 0.08 nM 和 0.17 nM。

别名：BMS-562247-01；Apixaban；阿哌沙班；

物理性状及指标：

外观：.....白色粉末

溶解性：.....DMSO : 18 mg/mL (39.17 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98.5%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Apixaban 是一种高度选择性的，可逆的 Factor Xa 抑制剂，在人和兔子中 K_i 分别为 0.08 nM 和 0.17 nM。	
特性	Apixaban 是高选择性，可逆的 Factor Xa 抑制剂。	
靶点	Factor Xa (human) (Cell-free assay)	Factor Xa (rabbit) (Cell-free assay)
	0.08 nM(K_i)	0.17 nM(K_i)
体外研究	Apixaban 是高度选择且有效作用于，人 Factor Xa 兔 Factor Xa 抑制剂， K_i 分别为 0.08 nM 和 0.17 nM。在体外，Apixaban 作用于正常人血浆，延长人凝血时间，使凝血酶原时间(PT)，改良凝血酶原时间(mPT)，活化部分凝血活酶时间(APTT) 和 HepTest 增加一倍，所需的浓度 (EC_{2x}) 分别为 3.6 μ M, 0.37 μ M, 7.4 μ M, 和 0.4 μ M, 此外，在 PT 和 APTT 实验中，Apixaban 最高效作用于人和兔血浆，而作用于大鼠和犬血浆则效果较低。	

体内研究	Apixaban 作用于犬，具有优良的药代动力学特性，极低间隙(CI: 0.02 L kg ⁻¹ h ⁻¹)，低体积分布 (V _{dss} : 0.2 L kg ⁻¹)。此外，Apixaban 也具有适度半衰期(T _{1/2} : 5.8 小时)和良好的口服生物有效性(F: 58%)。Apixaban 作用于动静脉分流血栓形成(AVST)，静脉血栓形成(VT)，和电介导颈动脉血栓(ECAT) 兔子模型，具有抗血栓形成效果，EC50 分别为 270 nM, 110 nM 和 70 nM。
-------------	--

美仑相关产品推荐

MB1878	利伐沙班
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。阿匹沙班(BMS-562247-01；BMS 562247-01)是一种直接因子 Xa 抑制剂，是一种抗凝剂。对人和兔因子 Xa (FXA) 具有相似的亲和力。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1763 mL	10.8814 mL	21.7628 mL
5 mM	0.4353 mL	2.1763 mL	4.3526 mL
10 mM	0.2176 mL	1.0881 mL	2.1763 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	纯化后的 FXA 用罗素蝰蛇毒液激活，随后进行亲和层析。由十二烷基硫酸钠-聚丙烯酰胺凝胶电泳判断所得 FXA 纯度为 95%。用显色底物 S-2765 测定了人、兔、大鼠和狗 FXa 的底物亲和力和值，用 Michaelis-Menten-Henri 常数(K _m)表示，分别为 36、60、240 和 70μM。使用.aMax 384 Plus 平板阅读器和 SoftMax，通过测量 25°C下 405nm 的吸光度长达 30 分钟来监测底物水解。每个底物和抑制剂浓度对的 FXA 活性是重复的。用 GRAFIT 将稳态底物水解速率与竞争抑制方程(方程 1)进行非线性最小二乘拟合，计算 K _i 值，其中 v 等于 OD _{min_1} 中的反应速度，V _{max} 等于最大反应速度，S 等于底物浓度。并且，i 等于抑制剂浓度。
动物实验	Animal Models: 动静脉分流血栓形成(AVST)，静脉血栓形成(VT) 和电介导颈动脉血栓 (ECAT)兔模型 Formulation: 溶于 10% N,N-二甲基乙酰胺; 30% 1,2-丙二醇; 60% 水 Dosages: ≤3 mg/kg/h Administration: 静脉注射

【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(M ²)	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。