

## Sitaxsentan sodium; TBC-11251; Thelin ; 西他塞坦钠 ; 司他生坦钠

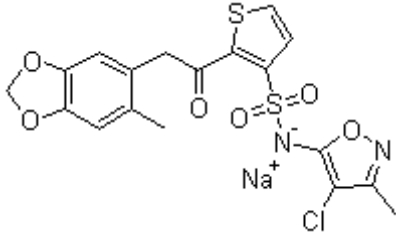
产品编号：MB1887

质量标准：纯度 99%

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：黄色或淡黄色粉末

### 基本信息

分子式	C18H14ClN2NaO6S2	结 构 式	
分子量	476.89		
CAS No.	210421-74-2		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 40 mg/mL Ethanol 20 mg/mL Water 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：**司他生坦钠 Sitaxsentan sodium 是一种有效的，选择性的 **endothelin A receptor** 拮抗剂。

**别名：**TBC11251 sodium salt; TBC11251 ;

3-Thiophenesulfonamide,

N-(4-chloro-3-methyl-5-isoxazolyl)-2-[2-(6-methyl-1,3-benzodioxol-5-yl)acetyl]-, sodium salt (1:1)

### 物理性状及指标：

外观：.....黄色或淡黄色粉末

溶解性：.....DMSO 40 mg/mL ; Water <1 mg/mL ; Ethanol 20 mg/mL

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....99.0%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	西他生坦（钠）是一种口服活性，高选择性的内皮素 A 受体拮抗剂。
<b>体外研究</b>	西他生坦和波生坦在较高浓度下减弱 NTCP 转运，并抑制人肝转运蛋白，这在临床环境中观察到的这些药物的肝毒性增加提供了潜在的机制。只有 sitaxsentan 减少了 OATP 运输（52%）。西他生坦和西他生坦联合西地那非完全预防内皮素-1 和 ETB 受体的表达增加。单独的西他生坦可部分恢复 BMPR-1A 和 BMPR-2 的表达。西地那非和西他生坦的组合进一步恢复了 BMPR-1A 和 BMPR-2 的表达，然而，与对照组相比，BMPR-1A 和 BMPR-2 的表达降低了。
<b>体内研究</b>	西他生坦（在缺氧发作前 10 分钟静脉注射 5mg / kg）完全阻断缺氧诱导的血管收缩，该组与空气对照无差异。西他生坦的口服给药显著减弱 MPAP 的增加，而西他生坦给予暴露于正常氧水平的大鼠对 MPAP 没有影响。西他生坦单独限制了分流诱导的 MT 增加。西他生坦与西地那非联合使用可以更有效地防止这种重塑，然而，与对照相比，这种重塑往往会增加。

### 美仑相关产品推荐

MB25699

西他生坦钠-13C4

**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。西他司坦钠(TBC11251 钠盐)是内皮素 A 受体的一种口服活性高选择性拮抗剂。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.0969 mL	10.4846 mL	20.9692 mL
5 mM		0.4194 mL	2.0969 mL	4.1938 mL
10 mM		0.2097 mL	1.0485 mL	2.0969 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>动物实验</b>	西他生坦是在水中形成的。在持续暴露于缺氧环境中，在最初 2 周的低氧暴露(10% O <sub>2</sub> ) sitaxsentan(每天饮用水中的体重为 15 或 30 mg/kg)后，持续暴露于缺氧环境中 4 周。在缺氧 4 周结束时，行股动脉和肺动脉插管，测量 MPAP、MSAP、HR。
-------------	--

**【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。