

Ticagrelor(AZD 6140) ; 替卡格雷

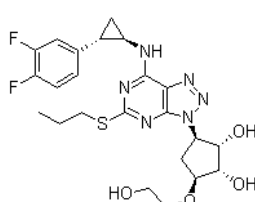
产品编号：MB2071

质量标准：>99%,II 晶型

包装规格：20MG;100MG

产品形式：白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C ₂₃ H ₂₈ F ₂ N ₆ O ₄ S	结构式	
分子量	522.57		
CAS No.	274693-27-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (191.36 mM) Water Insoluble Ethanol 53 mg/mL (101.42 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：替卡格雷 Ticagrelor (AZD6140)是可逆有口服活性的 **P2Y₁₂** 受体拮抗剂，可用来治疗血小板聚集。

别名：替卡格雷;替格瑞洛;AR-C 126532XX; AZD 6140;AZD6140;AZD-6140

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色结晶性粉末

溶解性：.....DMSO :100 mg/mL (191.36 mM) ;Water Insoluble ;Ethanol 53 mg/mL (101.42 mM)

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....≥99%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Ticagrelor 是第一个口服的可以可逆结合的 P2Y₁₂ 受体拮抗剂。		
特性	首创新型 P2Y ₁₂ 拮抗剂，称为环戊基-三唑-嘧啶。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>P2Y₁₂</td> </tr> <tr> <td>2 nM(Ki)</td> </tr> </table>	P2Y ₁₂	2 nM(Ki)
P2Y ₁₂			
2 nM(Ki)			
体外研究	Ticagrelor 是活性药物，肠道吸收后不需要代谢活化。它不直接与 ADP 在 ADP 结合位点竞争，但是会占据邻近的结合位点，并以构象效应的方式发挥作用，导致一个可逆的受体的构象变化。Ticagrelor 与受体可逆结合，快速起效并快速失效。rh-P2Y ₁₂ 受体转染的 CHO-K1 中的结合研究表明，ticagrelor 表现出有效，快速，可逆的结合，K _d 为 10.5 nM，k _{on} (结合常数)为 0.00011/(nM•s)，k _{off} (解离常数)为 0.00087/s，结合的半衰期值为 4 分钟，解离的半衰期值为 14 分钟，表明血小板的抑制大小取决于可结合血小板的药物浓度。Ticagrelor 适度抑制人肝微粒体中 CYP2C9 活性，而对 CYP1A2 ,CYP2B6 ,CYP2C8 ,CYP2C19 ,CYP2D6，和 CYP2E1 几乎没有抑制活性。在人肝微粒体中，ticagrelor 抑制咪达唑仑 4-羟基化，而激		

	活咪达唑仑 1-羟基化。在新鲜人肝细胞中评估, ticagrelor 不是 CYP1A2 或 CYP3A4 的诱导剂。
体内研究	Ticagrelor 吸收迅速, t_{max} 为 1.3-2 小时。在所研究的剂量范围内, C_{max} 和血药浓度时间曲线下从时间 0 到无穷大的面积以明显的剂量比例增加, 表明其线性药动力学。Ticagrelor 的平均终期半衰期($t_{1/2}$) 大约为 7-8.5 小时。血小板聚集(IPA)的抑制剂量相关 并且在 100-400 毫克下 2 小时会完全抑制。Ticagrelor 耐受性良好, 没有严重的或者剂量相关的不良事件, 也没有观察到显著的实验值变化。

美仑相关产品推荐

MB2071-S	替卡格雷(标准品)
----------	-----------

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。替卡格雷是一种新型的、具有选择性的小分子抗凝血药。该药能可逆性地作用于血管平滑肌细胞(VSMC)上的嘌呤 2 受体(purinoreceptor 2, P2)亚型 P2Y12, 不需要代谢激活, 对二磷酸腺苷 (ADP) 引起的小血小板聚集有明显的抑制作用, 且口服使用后起效迅速, 能有效改善急性冠心病患者的症状。与噻吩并吡啶类药物不同, 替卡格雷对 P2Y12 受体是可逆抑制剂, 所以对于那些需在先期进行抗凝治疗后再行手术的病人尤为适用。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9136 mL	9.5681 mL	19.1362 mL
5 mM	0.3827 mL	1.9136 mL	3.8272 mL
10 mM	0.1914 mL	0.9568 mL	1.9136 mL
50 mM	0.0383 mL	0.1914 mL	0.3827 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。