

Fimasartan

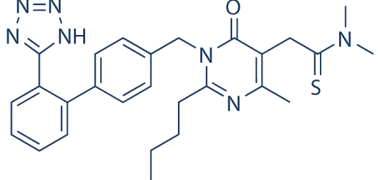
产品编号: MB3599

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg/25mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C27H31N7OS	结 构 式	
分子量	501.65		
CAS No.	247257-48-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble DMSO: 100 mg/mL (199.34 mM) Ethanol: 24 mg/mL (47.84 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: Fimasartan 是一种非肽段的 angiotensin II receptor 拮抗剂, 与 AT1 受体非竞争性地结合。用于高血压和心力衰竭的治疗中。

中文名: 非马沙坦

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: 24 mg/mL (47.84 mM); DMSO: 100 mg/mL (199.34 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Fimasartan 是一种非肽段的 angiotensin II receptor 拮抗剂, 与 AT1 受体非竞争性地结合。用于高血压和心力衰竭的治疗中。	
IC50 & Target	AT1 receptor	
体外	Fimasartan is a selective AT1 receptor antagonist. The concentration that inhibits the binding of [125I]Ang II to the AT1 receptor from rat adrenal cortex by 50% (IC50) is 0.13 nM. Fimasartan shows superior inhibitory activity in the contraction of isolated rabbit thoracic aorta compared to other ARBs such as losartan and candesartan. Fimasartan potently attenuates myocardial apoptotic death in reperfused rat heart and H9c2 cells. Fimasartan	

	could attenuate mitochondrial damage which is associated with minimizing the reduction in Bcl-2 and connected with the reduction in p53 and activation of Akt and GSK-3 β , and inhibiting mitochondrial Ca $^{2+}$ overload by suppressing the ICa,L and MCU.
体内	In various animal models including renal hypertensive rats, spontaneously hypertensive rats and Beagle dogs, fimasartan effectively reduces blood pressure in a dose-dependent manner following single or repeated oral and intravenous administration. Fimasartan does not affect general behavior, respiratory rate or tidal volume in experimental animals, and shows no adverse findings in the human ether-a-go-go-related gene (hERG) test or monkey telemetry study. A number of general toxicity, carcinogenic toxicity, genetic toxicity, and developmental toxicity studies given either orally or intravenously in various species including mice, rats, monkeys and dogs are conducted and these preclinical results demonstrate the safety and tolerability of fimasartan for long-term clinical use and offer sufficient safety margins to support the expected human therapeutic dose. Fimasartan is rapidly absorbed following oral administration with the time to peak plasma concentration (Tmax) ranging 0.5-3 h and the terminal half-life (t1/2) being 5-16 h at doses of 20 to 480 mg in healthy subjects. Similar results are obtained in patients with hypertension, i.e., Tmax ranges 0.5-1.3 h and t1/2 is 7-10 h following fimasartan administration at doses 20-180 mg in the subsequent phase II study. The urinary excretion of fimasartan is low, with the overall urinary excretion of unchanged drug over the first 24 h after dosing being less than 3% of the administered dose. Fimasartan undergoes nonrenal elimination with minimal metabolism. Fimasartan treatment before myocardial ischemia significantly attenuates reperfusion injury and apoptotic changes, possibly by suppressing mitochondrial damage during reperfusion. In various preclinical studies, including aortic balloon injury, myocardial infarct ischemia/reperfusion, doxorubicin cardiotoxicity, and ischemic stroke models, fimasartan shows anti-inflammatory and organ-protecting effects.

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1272	Enalapril Maleate
MB1578	Losartan Potassium
MB2800	Eprosartan mesylate

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热(在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

浓度	DMSO 质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9934 mL	9.9671 mL	19.9342 mL
5 mM	0.3987 mL	1.9934 mL	3.9868 mL
10 mM	0.1993 mL	0.9967 mL	1.9934 mL
50 mM	0.0399 mL	0.1993 mL	0.3987 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，请选择合适溶剂，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。