

**Vonoprazan Fumarate (TAK-438) ; 富马酸沃诺拉赞**

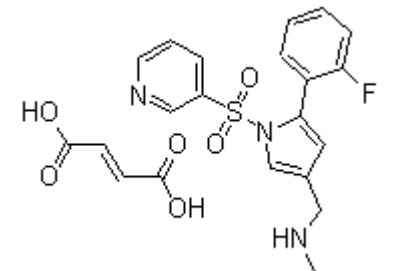
产品编号 : MB3726

质量标准 : &gt;98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : 粉状

**基本信息**

分子式	C17H16FN3O2S.C4H4O4	结 构 式	
分子量	461.46		
CAS No.	1260141-27-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 62 mg/mL (134.35 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 :** 富马酸沃诺拉赞 TAK-438 是有一种口服活性的钾竞争性酸阻断剂, 抑制 H<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>-ATPase。**别名 :** TAK-438; TAK 438;

5-(2-Fluorophenyl)-N-methyl-1-(3-pyridinylsulfonyl)-1H-pyrrole-3-methanamine 2-butenedioate

**物理性状及指标 :**

外观 : .....白色至类白色粉末

溶解性 : .....DMSO : 62 mg/mL (134.35 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....&gt;98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥**生物活性**

<b>产品描述</b>	TAK-438 是新型 P-CAB(钾离子竞争性酸抑制剂), 可逆抑制 H <sup>+</sup> /K <sup>+</sup> , ATPase, IC50 为 19 nM (pH 6.5), 控制胃酸分泌。
<b>靶点</b>	H <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase
<b>IC50</b>	19 nM

<b>体外研究</b>	TAK-438 是一种吡咯类衍生物，具有与 P-CABs 完全不同的化学结构。TAK-438 抑制胃部 H <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase 活性，这种作用存在浓度依赖性。在中性条件下 (pH7.5)，TAK-438 的抑制活性与在弱酸性条件下 (pH 为 6.5) 几乎相同。TAK-438 不抑制 Na <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase 活性，即使浓度高于其作用于胃部 H <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase 活性的 IC50 值 500 倍。TAK-438 抑制胃部 H <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase 活性，按 K <sup>+</sup> 竞争性的方式，Ki 为 3 nM。
<b>体内研究</b>	TAK-438 抑制基础胃酸分泌，这种作用存在剂量依赖性，ID50 值为 1.26 mg/kg。TAK-438 静脉给药，增加胃部灌注液的 pH 值，这种作用存在剂量依赖性，增加的 pH 值在给药后维持 5 小时。TAK-438 按 1 mg/kg 剂量处理，90 分钟后，pH 值达到稳定状态，最高 pH 值为 5.9。此外，TAK-438 处理大鼠和狗，有效且更持久地抑制组胺刺激的胃酸分泌。TAK-438 通过胃组织的高积累和低清除力，具有显著的抗分泌活性。TAK-438 不受胃液分泌状态影响，不像 PPIs。
<b>特征</b>	在酸性和中性环境下，TAK-438 都可抑制 H <sup>+</sup> , K <sup>+</sup> -ATPase。

**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)**

MB4140	TRAM-34
MB3725	多非利特
MB2085	瑞格列奈
MB1691	Tolbutamide

**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。富马酸沃诺拉赞 TAK-438 是有一种口服活性的**钾竞争性酸阻断剂**，抑制 H<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>-ATPase。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1670 mL	10.8352 mL	21.6704 mL
5 mM	0.4334 mL	2.1670 mL	4.3341 mL
10 mM	0.2167 mL	1.0835 mL	2.1670 mL
50 mM	0.0433 mL	0.2167 mL	0.4334 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>动物实验：</b>	<b>Animal Models:</b> 雄性 Sprague-Dawley 大鼠
--------------	--

	<p><b>Formulation:</b> 0.5% 甲基纤维素溶液</p> <p><b>Dosages:</b> 1, 2, 和 4 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理</p>
--	---

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。