

## Acridinium Bromide ; 阿地溴铵

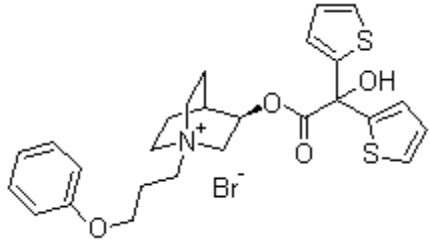
产品编号 : MB4274

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;100MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> NO <sub>4</sub> S <sub>2</sub> .Br	结 构 式	
分子量	564.55		
CAS No.	320345-99-1		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 113 mg/mL (200.15 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 :** 溴化 Acridinium(LAS 34273; LAS-W 330)是长效的可吸入型毒蕈碱拮抗剂, 可用于慢性阻塞性肺病 ( COPD ) 的维持治疗。

**别名 :** 阿地溴铵 ; LAS 34273; LAS-W 330 ; 1-Azoniabicyclo[2.2.2]octane, 3-[(2-hydroxy-2,2-di-2-thienylacetyl)oxy]-1-(3-phenoxypropyl)-, bromide (1:1), (3R)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....类白色至粉色固体

溶解性 : .....DMSO 113 mg/mL (200.15 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Acridinium Bromide 与人源毒蕈碱受体 AChR M1, M2, M3, M4 和 M5 结合, K <sub>i</sub> 值分别为 0.1 nM, 0.14 nM, 0.14 nM, 0.21 nM 和 0.16 nM。				
<b>特性</b>	近似等效于 Tiotropium, 对毒蕈碱受体亚型比 Ipratropium 有效 8-16 倍。				
<b>靶点</b>	M1 mAChR	M2 mAChR	M3 mAChR	M5 mAChR	M4 mAChR

	0.1 nM(Ki)	0.14 nM(Ki)	0.14 nM(Ki)	0.16 nM(Ki)	0.21 nM(Ki)
<b>体外研究</b>	<p>[<sup>3</sup>H]Aclidinium 与 M2 的同质受体结合, Kd 为 0.34 nM, Bmax 为 3.13 pmol/mg, 与 M3 结合, Kd 为 0.34 nM, Bmax 为 3.13 pmol/mg。Aclidinium (&lt; 100 nM) 剂量依赖性抑制乙酰胆碱诱导的离体豚鼠气管的收缩。在离体的豚鼠气管中, Aclidinium 显示出起始作用, t<sub>1/2</sub> 为 6.8 分钟, t<sub>max</sub> 为 35.9 分钟。Aclidinium 在所有物种的血浆样品中是水解的, 37°C 下, 在大鼠, 豚鼠, 狗和人的血浆中, 表观半衰期分别为 11.7 分钟, 38.3 分钟, 1.8 分钟和 2.4 分钟。在人支气管成纤维细胞中, Aclidinium (0.1 μM) 抑制乙酰胆碱和 TGF-β1 诱导的 I 型胶原上调, 并抑制 α-SMA mRNA 和蛋白质表达。在人支气管成纤维细胞中, Aclidinium (0.1 μM) 抑制 TGF-β1 诱导的 ChAT 表达上调。在人支气管成纤维细胞中, Aclidinium (0.1 μM) 抑制乙酰胆碱和 TGF-β1 诱导的 ERK1/2 磷酸化作用和 RhoA-GTP 形成的增加。在人肺成纤维细胞中, Aclidinium 预处理防止 M1 和 M3 的上调, 但不影响乙酰胆碱或 TGF-β1 诱导的 M2 下调。在人肺成纤维细胞中, Aclidinium (0.1 μM) 剂量依赖性抑制 TGF-β1 和乙酰胆碱诱导的细胞增殖。</p>				
<b>体内研究</b>	<p>在麻醉的豚鼠体内, 乙酰胆碱诱导的支气管收缩模型中, Aclidinium 显示出起始作用, IC50 (95% CI) 为 140 微克/毫升, t<sub>max</sub> 为 30 分钟。在有意识的比格犬体内, Aclidinium (500 微克/千克) 给药 1 小时后诱导心率最大增加 55%。在麻醉的豚鼠体内, 超过 120 分钟的研究期间, Aclidinium (1 毫克/毫升) 产生一个有效持久的气管保护作用(72%–88.4%)。</p>				

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)

MB4267	奥替溴铵
MB1620	罗库溴铵
MB4265	富马酸非索罗定

**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。溴化 Aclidinium(LAS 34273; LAS-W 330) 是长效的可吸入型毒蕈碱拮抗剂, 可用于慢性阻塞性肺病 (COPD) 的维持治疗。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7713 mL	8.8566 mL	17.7132 mL
5 mM	0.3543 mL	1.7713 mL	3.5426 mL
10 mM	0.1771 mL	0.8857 mL	1.7713 mL
50 mM	0.0354 mL	0.1771 mL	0.3543 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<p><b>激酶实验</b></p>	<p><b>亲和力测试:</b></p> <p>[<sup>3</sup>H]NMS 与表达人毒蕈碱受体亚型之一的细胞膜制剂结合, Aclidinium 对不同的人毒蕈碱受体亚型在平衡时的亲和力, 通过其置换 [<sup>3</sup>H]NMS 的能力测定。对 M1, M2, M3, M4, 和 M5 受体膜制剂的蛋白质浓度分别为 8.1 微克/孔, 10.0 微克/孔, 4.9 微克/孔, 4.5 微克/孔, 以及 5.0 微克/孔。对不同毒蕈碱受体亚型, 这些测试在 [<sup>3</sup>H]NMS 浓度近似等于放射性配体解离常数(Kd)下进行。 [<sup>3</sup>H]NMS 的浓度, 对 M1 和 M4 的测试为 0.3 nM, 对 M2, M3, 和 M5 的测试为 1 nM。重复测定两份一系列拮抗剂浓度(10<sup>-14</sup> 到 10<sup>-5</sup> M)以得到竞争曲线。非特异性结合在阿托品 (1 μM)存在下测定。试验试剂溶解在测试结合缓冲液中含有钙和镁的磷酸盐缓冲盐溶液, 总体积为 200 微升。室温下在 96 孔微量滴定板中培育 2 小时或 6 小时 (M1-M4 和 M5, 分别), 以确保达到平衡, 将 150 微升等份反应液转移到 GF/C 滤板, 用含有 0.05% 聚乙烯亚胺的清洗缓冲液(50 mM Tris, 100 mM NaCl, pH 7.4)预处理 1 小时。结合的和游离的 [<sup>3</sup>H]NMS 通过快速真空过滤分离, 随后用冰预冷的清洗缓冲液清洗 4 次。在加入 30 微升 OptiPhase Supermix 前, 过滤器干燥 30 分钟, 放射性通过 MicroBeta Trilux 微孔板闪烁计数器定量。</p>
<p><b>细胞实验</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> 人支气管成纤维细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 100 nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 人支气管成纤维细胞增殖, 如先前概述, 根据制造说明使用细胞增殖酶联免疫吸附测定 BrdU 试剂盒, 由 DNA 合成时基于 BrdU 整合的比色免疫测定。细胞以 3x10<sup>3</sup> 细胞/孔的密度接种在 96 孔板, 并培育 24 小时。随后将细胞暴露在不同实验条件下。使用微孔板分光光度计定量 490nm 处的吸光度。增殖数据是指每孔 BrdU 标记的细胞 DNA 含量的吸光度值。刺激被表示为未处理的对照组基底生长的 x 倍的增殖。</p>
<p><b>动物实验</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> 比格犬</p> <p><b>Formulation:</b> 气溶胶溶液</p> <p><b>Dosages:</b> 500 微克/千克</p> <p><b>Administration:</b> 通过喷雾器给药</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。如需制备储备液, 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。