

## Macitentan ; 马西替坦 ; ACT064992

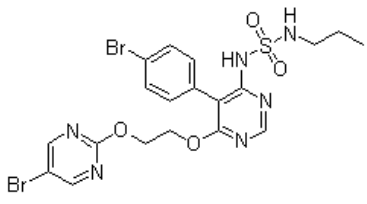
产品编号 : MB5020

质量标准 : >99%,内皮素(ET)受体拮抗剂

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C <sub>19</sub> H <sub>20</sub> Br <sub>2</sub> N <sub>6</sub> O <sub>4</sub> S	结 构 式	
分子量	588.27		
CAS No.	441798-33-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (169.98 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 :** 马西替坦 Macitentan 是有口服活性, 非肽类内皮素受体拮抗剂, 用于治疗特发性肺纤维化和肺动脉高压。

**别名 :** ACT-064992 ; Sulfamide, N-[5-(4-bromophenyl)-6-[2-[(5-bromo-2-pyrimidinyl)oxy]ethoxy]-4-pyrimidinyl]-N'-propyl

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (169.98 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

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	Macitentan 是一种口服有效的, 非肽类, ETA/ETB(内皮素) receptor 双重拮抗剂, IC <sub>50</sub> 为 0.5 nM/391 nM。	
靶点	ET-A	ET-B

	0.5 nM	391 nM
<b>体外研究</b>	Macitentan 作用于原代人类肺平滑肌细胞，全面抑制 ET-1 诱导的细胞内钙离子增加，IC50 为 1 nM。Macitentan 作用于离体的大鼠主动脉环或离体的大鼠气管环，分别抑制 ET-1 诱导的收缩或 S6c 诱导的收缩，pA2 分别为 7.6 和 5.9。	
<b>体内研究</b>	<p>Macitentan 处理正常血压大鼠，增加血浆 ET-1 浓度，使用剂量比 Bosentan 低 10 倍。Macitentan 处理高血压 DOCA-盐大鼠，降低平均动脉压，这种作用存在剂量依赖性，按 10 mg/kg 剂量处理达到最大效果，为 -26 mm Hg，ED50 为 1mg/kg。Macitentan 按最大有效剂量处理，血压反应持续时间约 40 小时。Macitentan 口服处理野百合碱诱导的肺高血压大鼠，抑制肺动脉高压和右心室肥厚，最大功效为 30 mg/kg/day，这种作用存在剂量依赖性。Macitentan 每天按 30 mg/kg 剂量慢性口服处理野百合碱诱导的大鼠，显著提高 42 天生存率（Macitentan 与对照组的存活率为 83 与 50%；在 42 天死亡率降低 66%）。</p> <p>Macitentan 每天按 30 mg/kg 剂量处理链脲左菌素诱导的糖尿病大鼠模型 24 小时，部分抑制肾血管收缩，并增加肾血流量。Macitentan 增加肾小球滤过率，并降低滤过分数，且衰减血管和肾小管-间质病变，也造成肾小球损害。Macitentan 每天按 25 mg/kg 剂量口服处理 db/db 小鼠，降低肾脏，心脏和视网膜 ET-1, TGF-β1, VEGF, FN, EDB+FN, 胶原蛋白 α-I(IV) mRNA 表达增加，随着增加 FN, 胶原蛋白，及 II 型糖尿病诱导的 NF-κB 激活。Macitentan 处理这些糖尿病小鼠，还可改善肾小球系膜扩张，心功能不全，增加 ANP 和 BNP 表达。Macitentan (100mg/kg)与 Paclitaxel (5 mg/kg)联用，处理 SKOV3ip1 卵巢癌模型，与单独使用 Paclitaxel 相比，降低肿瘤发病率，且进一步降低了肿瘤的重量和腹水的发生率。Macitentan 与 Paclitaxel 联用，抑制 ETRs 的磷酸化，且通过降低 pVEGFR2, pAkt, 和 pMAPK 的水平而抑制肿瘤细胞的生存通路。Macitentan 增强 Paclitaxel 对肿瘤细胞分裂和凋亡的影响。</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)

MB3752	Zibotentan (ZD4054)
MB1887	西他塞坦钠/司他生坦钠

**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。本品 Macitentan 是一种内皮素受体拮抗剂，用于治疗肺动脉高压（PAH）。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	1.6999 mL	8.4995 mL	16.9990 mL
5 mM	0.3400 mL	1.6999 mL	3.3998 mL
10 mM	0.1700 mL	0.8499 mL	1.6999 mL

50 mM	0.0340 mL	0.1700 mL	0.3400 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(M <sup>2</sup> )	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。