

Darifenacin Hydrobromide ; 氢溴酸达非那新

产品编号 : MB5446

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C28H30N2O2.HBr	结 构 式	
分子量	507.47		
CAS No.	133099-07-7		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (197.05 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：氢溴酸达非那新 Darifenacin HBr(UK88525)是选择性 M3 蕈毒碱受体拮抗剂。**别名：**3-Pyrrolidineacetamide, 1-[2-(2,3-dihydro-5-benzofuranyl)ethyl]-.alpha.,.alpha.-diphenyl-, hydrobromide (1:1), (3S)-**物理性状及指标：**

外观：.....白色至类白色粉固体

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (197.05 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥**生物活性**

产品描述	Darifenacin HBr 是一种选择性的 M3 muscarinic (M3 蕈毒碱) 受体拮抗剂，pKi 为 8.9。
靶点	M3 mAChR 8.9(pKi)

体外研究	Darifenacin 使兴奋剂曲线非平行向右位移，并显著抑制(+) -顺式-二氧戊环在离体的大鼠膀胱中产生浓度依赖性收缩的最大响应。Darifenacin 使 MDCK 细胞中 R123 (P-糖蛋白探针) 累积产生浓度依赖性增加。Darifenacin 以明显的浓度依赖响应方式刺激 P-gp 细胞膜中 ATPase 活性，估计的 ED50 值为 1.6 μM。Darifenacin (100 nM) 在基底侧到顶端方向表现出显著更大的渗透性，导致大约 2.6 的 BBMEC 单层分子流出率。
体内研究	Darifenacin 剂量依赖性抑制体积诱导的膀胱收缩(VIBC _{AMP})的振幅，283.3 nmol/kg 剂量下产生 35%的抑制，最大抑制约为 50–55%。在雌性 Sprague-Dawley 大鼠体内，Darifenacin (0.1 mg/kg i.v.) 降低膀胱传入神经 Aδ 和 C 纤维活性，C 纤维上传入峰值的减少可能比 Aδ 纤维上的减少更加显著。在膀胱过度活动症患者(OAB)中，Darifenacin (7.5 mg 和 15 mg，每天)降低每周尿失禁发作次数，使其分别降低为基线的 67.7%和 72.8%，而安慰剂仅降低到 55.9%。膀胱过度活跃(OAB)患者体内，Darifenacin (7.5 mg 和 15 mg，每天)改善排尿频率，膀胱容量，尿急频率和严重性，以及尿失禁发生的次数，作用显著优于安慰剂。

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)

MB5446-S	氢溴酸达非那新(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。本品 Darifenacin HBr(UK88525)是选择性 M3 蕈毒碱受体拮抗剂，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	1.9706 mL	9.8530 mL	19.7060 mL
5 mM	0.3941 mL	1.9706 mL	3.9412 mL
10 mM	0.1971 mL	0.9853 mL	1.9706 mL
50 mM	0.0394 mL	0.1971 mL	0.3941 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。