

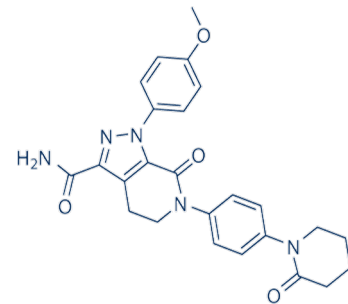
## Apixaban (Factor Xa抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0033-10mM	Apixaban (Factor Xa 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0033-5mg	Apixaban (Factor Xa 抑制剂)	5mg
SC0033-25mg	Apixaban (Factor Xa 抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	1-(4-methoxyphenyl)-7-oxo-6-[4-(2-oxopiperidin-1-yl)phenyl]-4,5-dihydropyrazolo[3,4-c]pyridine-3-carboxamide
简称	Apixaban
别名	BMS 562247, BMS-562247, BMS562247, BMS 562247-01, BMS-562247-01, BMS562247-01
中文名	阿派沙班
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>
分子量	459.5
CAS号	503612-47-3
纯度	96.5%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 18mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.09ml DMSO, 或者每4.60mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0033-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Apixaban是一种高度选择性的, 可逆的Factor Xa抑制剂, 在人和兔子中Ki分别为0.08nM和0.17nM。				
信号通路	Metabolism				
靶点	Factor Xa (human)	Factor Xa (rabbit)	—	—	—
IC50	0.08nM(Ki)	0.17nM(Ki)	—	—	—
体外研究	Apixaban是高度选择且有效作用于, 人Factor Xa兔Factor Xa抑制剂, Ki分别为0.08nM和0.17nM。在体外, Apixaban作用于正常人血浆, 延长人凝血时间, 使凝血酶原时间(PT), 改良凝血酶原时间(mPT), 活化部分凝血活酶时间(APTT) 和HepTest增加一倍, 所需的浓度(EC <sub>2x</sub> )分别为3.6μM、0.37μM、7.4μM和0.4μM, 此外, 在PT和APTT实验中, Apixaban最高效作用于人和兔血浆, 而作用于大鼠和犬血浆则效果较低。				
体内研究	Apixaban作用于犬, 具有优良的药代动力学特性, 极低间隙(Cl:0.02L·kg <sup>-1</sup> ·h <sup>-1</sup> ), 低体积分布 (V <sub>dss</sub> :0.2L·kg <sup>-1</sup> )。此外, Apixaban也具有适度半衰期(T <sub>1/2</sub> :5.8小时)和良好的口服生物有效性(F:58%)。Apixaban作用于动静脉分流血栓形成(AVST), 静脉血栓形成(VT)和电介导颈动脉血栓(ECAT)兔子模型, 具有抗血栓形成效果, EC50分别为270nM、110nM和70nM。				
临床实验	N/A				
特征	Apixaban是高选择性, 可逆的Factor Xa抑制剂。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	从纯化的人类酶中获得所有酶Ki值。所有fXa实验在微孔板上进行, 孔中包括全部体积为250μl的含0.2M NaCl和0.5% PEG-6000, pH为7.0的0.1M磷酸钠缓冲液。Apixaban按10μM、3.16μM、1.0μM、0.316μM、0.1μM、0.0316μM、0.01μM和0.00316μM进行实验。实验板在405nm处读数30分钟。在对照组(无抑制剂)和实验中(含抑制剂)中测定比率。Apixaban进行重复实验。与相同内部标准进行比较。组内分析误差和组间分析误差分别为5%和20%。所有酶实验在pH 7.4 buffer中在室温下进行。从人组织中纯化所有酶及通过商业途径获得。个别酶和底物Km在不同实验中测定, 与相关文献中所得数值相近。通过一系列浓度(1nM到50μM, 重复实验) 抑制剂与混合酶(0.1nM-100nM) 及肽底物(200μM-1000μM)温育30分钟, 测定对酶活性的稳态抑制。通过IC50值或每种浓度下抑制剂的抑制程度, 假设竞争性抑制和单个位点结合, 而计算Ki值。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	动静脉分流血栓形成(AVST)、静脉血栓形成(VT)和电介导颈动脉血栓(ECAT)兔模型
配制	溶于10% N,N-二甲基乙酰胺、30% 1,2-丙二醇、60%水
剂量	≤3mg/kg/h
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

1. Pinto DJ, et al. J Med Chem. 2007; 50(22):5339-5356.
2. Wong PC, et al. J Thromb Haemost. 2008; 6(5):820-829..
3. Zhang D, et al. J Thromb Thrombolysis. 2010; 29(1):70-80.
4. He K, et al. Eur J Drug Metab Pharmacokinet. 2011; 36(3):129-139.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC0033-10mM	Apixaban (Factor Xa抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0033-5mg	Apixaban (Factor Xa抑制剂)	5mg
SC0033-25mg	Apixaban (Factor Xa抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存, 至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月内有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页: <http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.12.12