

Macitentan

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Macitentan	53676ES08	5 mg
	53676ES25	25 mg

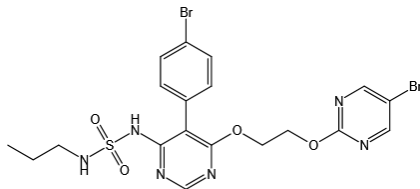
产品描述

Macitentan (ACT-064992, ACT064992), 又称马西替坦, 是可口服的、非多肽 ETA 和 ETB (内皮素受体) 双拮抗剂, IC_{50} 为 0.5 nM/391 nM, 能阻断内皮素诱导的气管和主动脉中的血管收缩, 临床上用于治疗肺动脉高压。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Macitentan, ACT-064992, ACT064992
中文名称 (Chinese Name)	马西替坦
靶点 (Target)	ETA, ETB
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--Endothelin Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	441798-33-0
分子式 (Formula)	$C_{19}H_{20}Br_2N_6O_4S$
分子量 (Molecular Weight)	588.27
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C , 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

当微血管内皮细胞与 BOS 或 macitentan 预孵育时, 管形成能力得以恢复, 同时也降低了间充质标记物的表达, 恢复了 CD31 的表达以及 VEGF-A 和 VEGF-A165b 之间的失衡。^[1] Macitentan 抑制 OATP1B1 介导的阿托伐他汀摄取和 OATP1B3 介导的雌酮-3-硫酸摄取, $IC_{50} \pm SE$ 值分别为 6.3 ± 0.7 和 $11.8 \pm 5.0 \mu M$ 。^[3] 用 macitentan 或 ACT-132577 治疗不会导致 HeyA8-MDR 中 R123 的细胞内积累, 表明这些化合物不是 P-gp 抑制剂。^[4]

(二) 细胞实验 (体外实验)

在 II 型糖尿病小鼠中, 口服 Macitentan (25 mg/kg) 可防止血管活性和纤维化因子的产生增加, NF- κ B 活化、结构和功能改变, 并增加细胞外基质蛋白的产生。^[2] 在 HeyA8-MDR 移植瘤小鼠模型中, 口服 Macitentan (10 mg/kg) 与每周一次的 5 mg/kg 紫杉醇联用显著减少瘤体大小。^[4]

参考文献

- [1]. Corallo C, et al. Bosentan and macitentan prevent the endothelial-to-mesenchymal transition (EndoMT) in systemic sclerosis: in vitro study. *Arthritis Res Ther*. 2016 Oct 6;18(1):228.
- [2]. Sen S, et al. Renal, retinal and cardiac changes in type 2 diabetes are attenuated by macitentan, a dual endothelin receptor antagonist. *Life Sci*. 2012 Oct 15;91(13-14):658-68.
- [3]. Bruderer S, et al. Effect of cyclosporine and rifampin on the pharmacokinetics of macitentan, a tissue-targeting dual endothelin receptor antagonist. *AAPS J*. 2012 Mar;14(1):68-78.
- [4]. Kim SJ, et al. Antivascular therapy for multidrug-resistant ovarian tumors by macitentan, a dual endothelin receptor antagonist. *Transl Oncol*. 2012 Feb;5(1):39-47.