

HB181204

Apixaban 阿哌沙班

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Apixaban 阿哌沙班	51205ES08	5 mg
Apixaban 阿哌沙班	51205ES25	25 mg

产品描述

Apixaban (阿哌沙班, 又称 BMS 562247-01, 商品名为 Eliquis) 是一种高度选择性的、可逆的、直接 Xa 因子抑制剂, 并抑制凝血酶原酶结合的 Xa 因子, 对人和兔 Xa 因子具有相似的亲和性, Ki 值分别为 0.08 nM 和 0.16 nM。

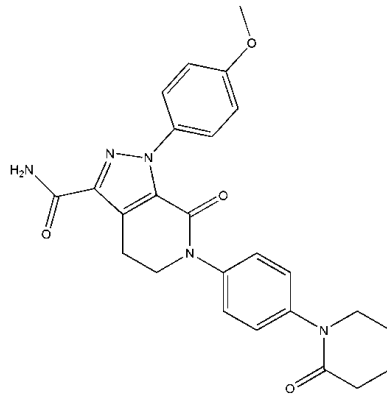
Apixaban 已批准上市, 作为抗凝剂用于预防静脉血栓栓塞(thromboembolism)和房颤中风。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Eliquis, BMS 562247-01
化学名 (Chemical Name)	1-(4-methoxyphenyl)-7-oxo-6-[4-(2-oxopiperidin-1-yl)phenyl]-4,5,6,7-tetrahydro-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridine-3-carboxamide
靶点 (Target)	Factor Xa
CAS 号 (CAS NO.)	503612-47-3
分子式 (Molecular Formula)	C ₂₅ H ₂₅ N ₅ O ₄
分子量 (Molecular Weight)	459.5
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于 -20 ℃, 有效期 2 年。易溶于 DMSO。建议分装后 -20 ℃ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

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) 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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

在体外，Apixaban 对人、兔、大鼠和犬的 Xa 因子的抑制活性不同， K_i 值分别为 0.08、0.16、1.3、1.7 nM；并具有抗凝作用，所需的浓度(EC_{2x})分别为 3.6、2.3、7.9、6.7 μ M。^[5]

（二）动物实验（体内研究）

在动静脉分流血栓形成(AVST)和静脉血栓形成(VT)预防模型中，Apixaban (0.03-3 mg/kg/h) 具有抗血栓形成作用，该作用方式为剂量依赖型。^[4]

参考文献

- [1] A. G. Turpie. Oral, Direct Factor Xa Inhibitors in Development for the Prevention and Treatment of Thromboembolic Diseases. *Arteriosclerosis, Thrombosis, and Vascular Biology* 27(6): 1238-1247 (2007).
- [2] Zhang D, et al. Metabolism, pharmacokinetics and pharmacodynamics of the factor Xa inhibitor apixaban in rabbits. *J Thromb Thrombolysis*. 29(1): 70-80 (2010).
- [3] Pinto DJ, et al. Discovery of 1-(4-Methoxyphenyl)-7-oxo-6-(4-(2-oxopiperidin-1-yl)phenyl)-4,5,6,7-tetrahydro-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridine-3-carboxamide (Apixaban, BMS-562247), a Highly Potent, Selective, Efficacious, and Orally Bioavailable Inhibitor of Blood Coagulation Factor Xa. *J Med Chem*. 50(22): 5339-5356 (2007).
- [4] Wong PC, et al. Dose-Dependent Antithrombotic Effects of Apixaban, an Oral Direct Factor Xa Inhibitor, in Prevention and Treatment of Thrombosis in Rabbit Models of Arteriovenous-Shunt and Venous Thrombosis at Doses That Preserve Hemostasis. *Blood* 110: 933 (2007).
- [5] Wong PC, et al. Apixaban, an oral, direct and highly selective factor Xa inhibitor: in vitro, antithrombotic and antihemostatic studies. *J Thromb Haemost*. 6(5): 820-829 (2008).