

产品名称：环(D-ALPHA-天冬氨酰-L-脯氨酰-D-缬氨酰-L-亮氨酰-D-色氨酰)  
产品别名：BQ-123

生物活性:

Description	BQ-123 is a selective endothelin A receptors (ETAR) antagonist with an IC50 value of 7.3 nM and a Ki vaule of 25 nM[1][2].				
IC50 & Target	IC50: 7.3 nM (Endothelin A receptors)[1] Ki: 25 nM (Endothelin A receptors)[2]				
In Vivo	BQ-123 (3 mg/kg; i.v.; given 15 minutes before pentylenetetrazole (PTZ)) impedes the formation and spread of seizure to a great degree in PTZ (50 mg/kg; i.p.) +BQ-123 groups[3].				
	Animal Model:	Male Wistar albino rats[3]			
	Dosage:	3 mg/kg			
	Administration:	Intravenous injection; given 15 minutes before PTZ			
	Result:	Number of rats with major seizure decreased.			
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b> <b>DMSO : ≥ 34 mg/mL (55.67 mM)</b>  * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div><div>Solvent Concentration</div><div>Mass</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.6375 mL	8.1873 mL	16.3747 mL
		5 mM	0.3275 mL	1.6375 mL	3.2749 mL
		10 mM	0.1637 mL	0.8187 mL	1.6375 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液。一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。  储备液的保存方式和期限 -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。  <b>In Vivo:</b>  请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 <b>In Vitro</b> 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：  ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶				
	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.09 mM); Clear solution  此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.09 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。  以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀，向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。				
	2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.09 mM); Clear solution  此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.09 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。  以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。				

## References

- [1]. Spratt JC, et al. Systemic ETA receptor antagonism with BQ-123 blocks ET-1 induced forearm vasoconstriction and decreases peripheral vascular resistance in healthy men. Br J Pharmacol. 2001 Oct;134(3):648-54.
- [2]. Sakamoto A, et al. Distinct subdomains of human endothelin receptors determine their selectivity to endothelinA-selective antagonist and endothelinB-selective agonists. J Biol Chem. 1993 Apr 25;268(12):8547-53.
- [3]. Erdogan H et al. The protective effects of endothelin-A receptor antagonist BQ-123 in pentylentetrazole-induced seizure in rats. Hum Exp Toxicol, 2014 Oct, 33(10):1008-16.



源叶生物