

产品名称：**Bupivacaine Hydrochloride**

产品别名：**Bupivacaine HCl**

生物活性:					
Description	Bupivacaine HCl 可以与钠离子通道的胞内部分结合从而阻断进入神经细胞的钠离子流，用于治疗心律不齐。				
IC ₅₀ & Target	Sodium channel [4]				
In Vitro	仅体外作用 15 至 30 分钟，Bupivacaine 对牛关节软骨细胞和关节软骨有细胞毒性作用。[1] Bupivacaine 作用于分离线粒体，是氧消耗和磷酸二磷酸腺苷的解偶联剂。[2] 在分离的线粒体中，Bupivacaine 浓度依赖性导致线粒体去极化以及吡啶核苷酸氧化，这和在 1.5 mm 浓度 Bupivacaine pH7.4 时增加的耗氧量相符，而呼吸在较高浓度被抑制。Bupivacaine 使得转换孔的开口（PTP）通透性打开，PTP 是一个环孢菌素 A 敏感内膜通道，在许多形式的细胞死亡起着关键作用。Bupivacaine 导致线粒体去极化和吡啶核苷酸氧化，和细胞内游离钙离子，细胞色素 C 释放，以及 hypercontracture 在完整屈趾短纤维增加浓度相匹配。[3] 在分离的线粒体中，Bupivacaine 在使用的几秒钟内抑制 GIRK 通道，不管通道是通过所述毒蕈碱性受体或经由共表达 G 蛋白 G 的 γ 亚基直接激活。Bupivacaine 也抑制在不存在功能性百日咳毒素敏感的 G 蛋白时酒精引起 GIRK 电流[4]。Bupivacaine HCl 还能有效地抑制 cAMP 的产生，IC50 为 2.3 μM[6]。				
In Vivo	Bupivacaine 不仅诱导大鼠肌质网（SR）的 Ca2 +释放，而且还抑制了 SR 的钙的吸收，这主要受 SR 钙三磷酸腺苷酶的活性。[5]				
Solvent&Solubility	<i>In Vitro:</i> DMSO : 65 mg/mL (200.07 mM) Ethanol: 65 mg/mL (200.07 mM) Water: 23 mg/mL (70.79 mM)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.0780 mL	15.3898 mL	30.7796 mL
		5 mM	0.6156 mL	3.0780 mL	6.1559 mL
		10 mM	0.3078 mL	1.5390 mL	3.0780 mL
		50 mM	0.0616 mL	0.3078 mL	0.6156 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。					
References	[1] Chu CR, et al. Arthroscopy. 2006, 22(7), 693-699. [2] Sztark F, et al. Anesthesiology. 1998, 88(5), 1340-1349. [3] Irwin W, et al. J Biol Chem. 2002, 277(14), 12221-12227. [4] Zhou W, et al. Proc Natl Acad Sci U S A, 2001, 98(11), 6482-6487. [5] Zink W, et al. Anesthesiology. 2002, 97(3), 710-716. [6] Butterworth JF, et al. Anesthesiology. 1993, 79(1):88-95.				