

Dabigatran ; 达比加群 ; BIBR 953

产品编号 : MB2084

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG ; 200MG

产品形式 : 白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₅ N ₇ O ₃	结 构 式	
分子量	471.51		
CAS No.	211914-51-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	10% Trifluoroacetic acid water solution 33 mg/mL (69.98 mM) DMSO 0.5 mg/mL (1.06 mM) Ethanol 0.01 mg/mL (0.02 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : 达比加群 Dabigatran(BIB-953; BIBR 953ZW)是可逆的高活性直接凝血酶抑制剂(DTI), K_i 为 4.5 nM。

别名 : β -Alanine, N-[[2-[[[4-(aminoiminomethyl)phenyl]amino]methyl]-1-methyl-1H-benzimidazol-5-yl]carbonyl]-N-2-pyridinyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :10% Trifluoroacetic acid water solution 33 mg/mL (69.98 mM)
DMSO 0.5 mg/mL (1.06 mM) ; Ethanol 0.01 mg/mL (0.02 mM)

纯度 :>98%,BR

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

达比加群酯是一种可逆性和选择性直接凝血酶抑制剂(DTI)。有研究确定**达比加群**及其前药达比加群酯的分子效能和抗凝血剂功效。通过酶抑制和选择性分析, 表面等离子体共振研究, 血小板聚集, 凝血酶生成和体外和离体的凝血测定来实现。这些研究表明, 达比加群选择性和可逆地抑制人凝血酶(K_i : 4.5nM)以及凝血酶诱导的血小板聚集(IC₅₀) : 10nM), 而对其他血小板刺激剂没有抑制作用。作为内源性凝血酶潜能(ETP)测量的血小板贫血浆(PPP)中的凝血酶生成被浓度依赖性地抑制(IC₅₀) : 0.56 μ M)。达比加群在体外在不同种类中表现出浓度依赖性抗凝作用, 分别使浓度分别为 0.23,0.83 和 0.18 μ M 的人 PPP 中活化的部分促凝血酶原激酶时间(aPTT), 凝血酶原时间(PT)和 ecarin 凝血时间(ECT)加倍。在体内, 达比加群在大鼠(0.3,1 和 3mg / kg)和恒河猴(0.15,0.3 和 0.6mg / kg) 静脉内给药后剂量依赖性延长 aPTT。用清醒大鼠(10,20 和 50mg / kg) 或恒河猴(1,2.5 或 5mg / kg) 口服施用达比加群酯时观察到剂量和时间依赖性抗凝作用, 观察到在 30 和 120 之间的最大作用分钟后分别给药。这些数据表明达比加群是一种有效的选择性凝血酶抑制剂和作为前药达比加群酯的口服活性抗凝血剂。

产品描述	Dabigatran (BIBR 953)是一种有效的非肽类凝血酶抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 9.3 nM。		
特性	Dabigatran 是一种可逆的，竞争性的，直接的凝血酶抑制剂。		
靶点	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td>Thrombin (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>9.3 nM</td> </tr> </table>	Thrombin (Cell-free assay)	9.3 nM
Thrombin (Cell-free assay)			
9.3 nM			
体外研究	BIBR953 是一种非常有效的抗凝血剂。BIBR 953 显示出其终端苯基能够被亲水性更强的 2-吡啶基取代，而活性不会过多损失。BIBR 953 抑制凝血酶，纤溶酶，凝血因子 Xa，胰蛋白酶，tPA 和活化的蛋白质 C，Ki 分别为 4.5 nM，1.7 μM，3.8 μM，50 nM，45 μM 和 20 μM。BIBR 953 特异性可逆抑制凝血酶。		
体内研究	BIBR953 对大鼠 i.v.给药后，表现出最有效的活性。Dabigatran etexilate 口服给药后，dabigatran 的生物利用度为 7.2%。Dabigatran 口服治疗后主要通过粪便排泄，静脉注射后主要通过尿液排泄。Dabigatran 的平均终末半衰期大约为 8 小时。口服和静脉注射给药后，Dabigatran 酰基葡萄糖苷酸分别占 0.4% 和 4%。		

美仑相关产品推荐

MB0848	Vorapaxar
MB10062	[Cit5]-凝血酶受体激动肽-5
MB10260	[Phe1,Ser2]- 凝血酶受体激动剂肽-6
MB1368	凝血酶来源于牛血浆

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Dabigatran (BIBR 953) 是一种有效的非肽类凝血酶抑制剂。可用于相关科研领域的研究。

储液配置：

浓度 \ 质量 10% TFA (aq) 体积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1208 mL	10.6042 mL	21.2085 mL
5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2417 mL
10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 mL
50 mM	0.0424 mL	0.2121 mL	0.4242 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	凝血酶抑制的测定 BIBR953 的凝血酶抑制作用(IC50)通过市售显色分析试剂测定。人凝血酶(0.042 U/mL)与不同浓度 BIBR 953 在 DMSO 中的稀释液(浓度范围为 0.003 μM -100 μM)或对照组 DMSO 于 37°C 下预培养 10 分钟。将预培养混合物加入显色底物，甲苯磺酰基-甘氨酸-脯氨酸-精氨酸-4-硝基苯胺乙酸中，底物被凝血酶裂解，由于游离的硝基苯胺，405 nm 下的吸光度增加，在分光光度计上测量增加的吸光度。以 405 nm 下的吸光度对 BIBR 953 的浓度作图，计算抑制 50%凝血酶 (IC50)的 BIBR 953
-------------	--

	浓度。所有测量均重复两份进行，以两个测定的平均值来表示最终结果。
--	----------------------------------

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。