

## Birinapant

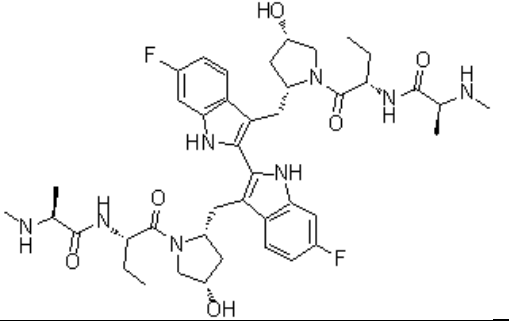
产品编号：MB4083

质量标准：>98%

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C42H56F2N8O6	结构式	
分子量	806.94		
CAS No.	1260251-31-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (123.92 mM) Water : Insoluble Ethanol : 55 mg/mL (68.15 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：** Birinapant 是一种二价 Smac 模拟物，是 XIAP 和 cIAP1 的强效拮抗剂，K<sub>d</sub> 值分别为 45 nM 和小于 1 nM。

**别名：** 比瑞那帕；TL32711；Propanamide, N,N'-[(6,6'-difluoro[2,2'-bi-1H-indole]-3,3'-diyl)bis[methylene[(2R,4S)-4-hydroxy-2,1-pyrrolidinediyl]][(1S)-1-ethyl-2-oxo-2,1-ethanediy]]]bis[2-(methylamino)-, (2S,2'S)-

### 物理性状及指标：

外观：.....类白色至淡黄色固体

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (123.92 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 55 mg/mL (68.15 mM)

含量：.....>98%

**储存条件：** -20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	Birinapant 是一种 SMAC 模拟拮抗剂，对 cIAP1 最有效，无细胞试验中 K <sub>d</sub> 为 <1 nM，对 XIAP 作用较弱。Phase 2。
------	--

靶点	cIAP1 (Cell-free assay)	XIAP (Cell-free assay)
	<1 nM(Kd)	45 nM(Kd)
体外研究	Birinapant 与 XIAP 和 CIAP1 结合的 $K_d$ 分别为 45 nM 和 <1 nM。在 TRAIL 不敏感 SUM190 ( ErbB2 的过度表达 ) 细胞中, Birinapant 独自诱导细胞死亡 ( IC 50 约为 300 nM ), 并显著增加 TRAIL 诱导的 TRAIL 敏感 SUM149 ( 三阴性, EGFR 活化 ) 细胞的凋亡。 Birinapant 导致 CIAP1 迅速降解, caspase 活化, PARP 裂解, 和 NF- $\kappa$ B 的激活。 Birinapant 与 TNF- $\alpha$ 联用表现出强烈的体外抗黑色素瘤作用。 Birinapant 和 TNF- $\alpha$ ( 1 ng/mL ) 联用抑制人黑色素瘤细胞系 WTH202, WM793B, WM1366 和 WM164 生长, IC50 分别为 1.8, 2.5, 7.9 和 9 nM, 而两种化合物单独都无效。 Birinapant 单独处理可诱导对 WM9 细胞增殖的抑制作用, IC 50 为 2.4 nM。 Birinapant 显著抑制这些细胞系中靶蛋白 CIAP1 和 cIAP2。	
体内研究	Birinapant ( 30 毫克/千克 ) 显著诱导恶性黑色素瘤异种移植模型 451LU 的肿瘤生长。	

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4555	AT406
MB4558	GDC-0152
MB4557	LCL-161

**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。 Birinapant 是一种二价 Smac 模拟物, 是 XIAP 和 cIAP1 的强效拮抗剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.2392 mL	6.1962 mL	12.3925 mL
5 mM	0.2478 mL	1.2392 mL	2.4785 mL
10 mM	0.1239 mL	0.6196 mL	1.2392 mL
50 mM	0.0248 mL	0.1239 mL	0.2478 mL

经典实验操作 ( 仅供参考 )

激酶实验	<b>荧光偏振测定法:</b> 和化合物 XIAP 和 CIAP1 的亲合力是使用荧光底物来确定, 并以 $K_d$ 值表示。最初, 荧光标记的修饰的 Smac 肽 ( AbuRPF -K ( 5-FAM ) -NH <sub>2</sub> ; FP 肽 ) 的解离常数 ( $K_d$ ) 是用固定
------	--

	浓度 (5 nM) 的肽和滴定不同浓度的蛋白质 (0.075-5 $\mu$ M 的半对数稀释) 来确定。剂量-反应曲线是在 5nM FP 肽和 50nM XIAP 检测中用 GraphPad Prism 的单点结合模型的非线性最小二乘法生产的。各种浓度的 Smac 模拟物 (100-0.001 $\mu$ M 在半对数稀释) 添加到 FP 肽/蛋白质二元复合物, 在含有 100 毫克/毫升牛 c-球蛋白 0.1M 磷酸钾缓冲液中室温处理 15 分钟。多标签读板器采用 485 nm 激发滤光片和 520nm 的发射滤光片测量偏振值。
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 人黑色素瘤细胞系 WM9</p> <p><b>Concentrations:</b> 1 nM-1 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 3 天</p> <p><b>Method:</b> 细胞附着 24 小时, 随后与 Birinapant 和/或 TNF-<math>\alpha</math> 孵育 24 或 72 小时。随后用 MTS 法检测。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 人黑色素瘤异种移植 451LU</p> <p><b>Formulation:</b> 12.5% 的 Captisol 在蒸馏水中</p> <p><b>Dosages:</b> 30 毫克/千克</p> <p><b>Administration:</b> 每周腹腔注射 3 次</p>

**【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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差, 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。