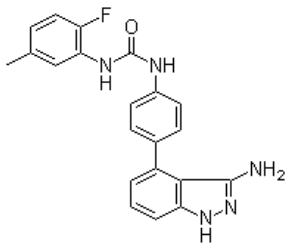
Linifanib (ABT-869)；利尼伐尼；ABT869

产品编号：MB5074
质量标准：>98%，VEGFR/PDGFR 抑制剂
包装规格：5MG;10MG;100MG
产品形式：solid

基本信息

分子式	C21H18FN5O	结构式	
分子量	375.41		
CAS No.	796967-16-3		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：75 mg/mL (199.78 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
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：Linifanib (ABT-869) 是一种多靶点 VEGF 和 PDGFR 受体家族的抑制剂，抑制 KDR，Flt-1，PDGFRβ 和 FLT3.

别名：利尼伐尼; ABT-869; AL-39324; Urea, N-[4-(3-amino-1H-indazol-4-yl)phenyl]-N'-(2-fluoro-5-methylphenyl)-

物理性状及指标：

外观：.....白色至灰色固体

溶解性：.....DMSO：75 mg/mL (199.78 mM);Water Insoluble;Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Linifanib (ABT-869)是一种新型有效的 ATP 竞争性 VEGFR/PDGFR 抑制剂，作用于 KDR，CSF-1R，Flt-1/3 和 PDGFRβ，其 IC50 分别为 4 nM，3 nM，3 nM/4 nM 和 66 nM，对突变激酶依赖性癌细胞（即 FLT3）最有效。
靶点	VEGFR1/FLT1 (Cell-free assay): 3 nM CSF-1R (Cell-free assay): 3 nM VEGFR2/KDR (Cell-free assay): 4 nM FLT3 (Cell-free assay): 4 nM Kit (Cell-free assay): 14 nM
体外研究	在激酶实验中，Linifanib 抑制 Kit, PDGFRβ 和 Flt4，IC50 分别为 14 nM, 66 nM 和 190 nM。在细胞水平，Linifanib 也抑制配体诱导的 KDR, PDGFR-β, KIT,和 CSF-1R 磷酸化，IC50 分别

本产品仅供科研使用。请勿用于医药、临床治疗、食品及化妆品用途。

	为 2 nM, 2 nM, 31 nM 和 10 nM，这种细胞效力可被血清蛋白影响。ABT-869 抑制 VEGF-刺激的 HUAEC 增殖，IC50 为 0.2 nM。然而，ABT-869 作用于不受 VEGF 或 PDGF 诱导的肿瘤细胞时活性很弱，除了作用于 MV4-11 白血病细胞(具有组成型活性形式 Flt3)，IC50 为 4 nM。Linifanib 作用于 MV4-11 细胞，降低 S 和 G2-M 期细胞凋亡数，提高 sub-G0-G1 期细胞凋亡数。Linifanib 结合到 CSF-1R 的 ATP 结合位点，K_i 为 3 nM。Linifanib(10 nM) 作用于 Ba/F3 FLT3 ITD 细胞，降低 Akt 在 Ser473 位点磷酸化，且降低 GSK3β 在 Ser9 位点磷酸化。

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)

MB7343	Foretinib (GSK1363089)
MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3945	Ki8751

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。Linifanib (ABT-869) 是一种多靶点 VEGF 和 PDGFR 受体家族的抑制剂，抑制 KDR，Flt-1，PDGFRβ 和 FLT3.，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6638 mL	13.3188 mL	26.6375 mL
5 mM	0.5328 mL	2.6638 mL	5.3275 mL
10 mM	0.2664 mL	1.3319 mL	2.6638 mL
50 mM	0.0533 mL	0.2664 mL	0.5328 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	激酶实验: 通过克隆到杆状病毒并表达激酶域的活性实验测定 IC50 值，杆状病毒使用 FastBac 杆状病毒表达系统。含有单个酪氨酸的生物素肽段用于酪氨酸激酶实验，加入 1 mM ATP，Eu-穴状化合物–标记的磷酸酪氨酸抗体(磷酸化位点在 tyr66)，及链霉抗生物素蛋白-APC，用时间分辨荧光分析。丝氨酸/苏氨酸激酶实验使用 5 μM ATP, [33P]ATP，及生物素肽段，使用 SA-闪光板测定 33P 的合并率。实验使用多种浓度的 ABT-869，用一系列 DMSO 储液稀释。使用不同浓度对应的数据回归曲线分析测定 IC50 值。
细胞实验	Cell lines: HUAEC, HT-29, HT1080, A431, MDA-435, MDA-231, H526, DLD-1, 9L 和 MV4-11 细胞 Concentrations: 0-100 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 细胞接种在 96 孔板上，每孔 2500 个细胞，在无血清培养基上温育 24 小时。加入 ABT-869 和 VEGF(最终浓度为 10 ng/ml)，在无血清培养基上继续温育 72 小时。癌细胞接种在全生长介质培养基上，每孔 3×103 个细胞，过夜处理。加入 ABT-869，在全生长介质培养基上继续温育 72 小时。白血病细胞接种在全生长介质培养基上，每孔 50×103 个，加入 ABT-869，继续温育 72

本产品仅供科研使用。请勿用于医药、临床治疗、食品及化妆品用途。

	小时。加入 Alamar Blue 测定细胞增殖，在 CO2 孵卵器中 37oC 下温育 4 小时，在荧光板读书器上分析。
动物实验	Animal Models: 携带 H526, DLD-1, MDA-231, MDA-435LM, HCT-116, H526, DLD-1, MDA-231, MDA-435LM, MV4-11 和 MX-1 移植瘤的小鼠 Formulation: 2%乙醇, 5%山梨酸酯 80, 20% PEG400, 及 73%盐水 Dosages: ~ 10 mg/kg Administration: 口服处理

【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。