

Nintedanib (BIBF1120); 尼达尼布; BIBF 1120

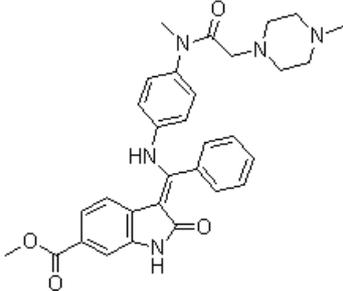
产品编号: MB7360

质量标准: >99%,BR

包装规格: 10MG;100MG;1G

产品形式: solid

基本信息

分子式	C31H33N5O4	结 构 式	
分子量	539.62		
CAS No.	656247-17-5; 928326-83-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 6 mg/mL (11.11 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 3 mg/mL (5.55 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: 尼达尼布 BIBF 1120 是一种有效的三重血管激酶抑制剂, 抑制 VEGFR1/2/3, FGFR1/2/3 和 PDGFR α/β .

别名: BIBF 1120; (Z)-methyl

3-(((4-(N-methyl-2-(4-methylpiperazin-1-yl)acetamido)phenyl)amino)(phenyl)methylene)-2-oxoindoline-6-carboxylate

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 6 mg/mL (11.11 mM);Water Insoluble;Ethanol : 3 mg/mL (5.55 mM)

含量:>99%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Nintedanib (BIBF 1120)是一种有效的三重血管激酶抑制剂,作用于VEGFR1/2/3, FGFR1/2/3 和 PDGFR α/β ,在无细胞试验中 IC50 分别为 34 nM/13 nM/13 nM, 69 nM/37 nM/108 nM 和 59 nM/65 nM。				
靶点	VEGFR2 (Cell-free assay)	VEGFR3 (Cell-free assay)	LCK (Cell-free assay)	FLT3 (Cell-free assay)	VEGFR1 (Cell-free assay)
	13 nM	13 nM	16 nM	26 nM	34 nM
体外研究	BIBF1120对酪氨酸激酶受体如EGFR, HER2, InsR, IGF1R 或者细胞周期激酶 CDK1, CDK2 和				

	CDK4 抑制效果不大, IC50 都大于 1×10^3 nM。BIBF1120 强抑制 VEGF-刺激的 HUVEC 和 VEGF-刺激的 HSMEC, EC50 分别为 9 和 7 nM。相反, BIBF1120 作用于 FaDu, Calu-6 和 Hela 时 EC50 则大到几百倍。
体内研究	在小鼠的 FadU 移植瘤中, 按鼠体重, 每千克处理 100mg BIBF1120, 结果显示肿瘤血管密度降低 76%。BIBF1120 作用于移植瘤模型 Caki-1, HT-29, SKOV-3, Calu6 和 PAC-120 同样有显著的抑制效果。BIBF1120 已用于治疗多种癌症, 包括: 非小细胞肺癌, 前列腺癌, 卵巢癌, 及结肠直肠癌。且 BIBF1120 目前处于二期临床实验阶段。

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)

MB3920	KRN633
MB3994	MGCD-265
MB3921	Motesanib Diphosphate (AMG-706)

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。尼达尼布 BIBF 1120 是一种有效的三重血管激酶抑制剂, 抑制 VEGFR1/2/3, FGFR1/2/3 和 PDGFR α/β , 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8532 mL	9.2658 mL	18.5316 mL
5 mM	0.3706 mL	1.8532 mL	3.7063 mL
10 mM	0.1853 mL	0.9266 mL	1.8532 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶实验:</p> <p>VEGFR-2 的胞质酪氨酸激酶域克隆到 pFastBac 载体上, 与谷胱甘肽巯基转移酶 (GST) 相融合。GST 融合蛋白在 SF-9 昆虫细胞中表达, 用重元素萃取分离法提取。HEPEX 萃取液包括 20 mM HEPES (pH 为 7.4), 100 mM NaCl, 10 mM ss-甘油磷酸盐, 10 mM 聚硝基磷酸单苯酯, 30mM NaF, 5 mM EDTA, 5% 甘油, 1% Triton X-100, 1 mM Na₃VO₄, 0.1% SDS, 0.5μg/ml 抑肽素 A, 2.5 μg/ml 3,4-二氯异香豆素(丝氨酸蛋白酶的不可逆抑制剂), 2.5 μg/ml 反式-环氧琥珀酰-L-亮氨酸-L-氨基丁烷, 20 KIU/ml 抑肽酶, 2 μg/ml 亮抑肽酶, 1 mM 苯甲脒, 和 0.002% PMSF。谷氨酸和酪氨酸按 4:1 比例随机组成的聚合物作为基底物, 每组 50ul 的反应液包括 5% DMSO, 40 mM HEPES (pH 为 7.4), 5 mM MgCl₂, 5 mM MnCl₂, 0.5 mg/ml 聚谷氨酸/酪氨酸, 0.05% Triton X-100, 100 μM ATP, 1 μCi [γ-33P]ATP, 和 10 μl 酶制剂。实验在室温下进行 20 分钟, 最后加入 10 μl 5% H₃PO₄ 终止反应。沉淀物转移到 GF/B 过滤器中, 使用与 96 孔过滤器相配的万能采集器收集。通过闪烁计数器测定混合物的放射能。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HUVEC, HUASMC, 和 BRP 细胞系</p> <p>Concentrations: 50 nM</p>

	<p>Incubation Time: 2 小时</p> <p>Method: 不同的肿瘤细胞系在 96 孔板上培养 24 小时。然后加入不同浓度的 BIBF1120, 处理 72 小时。通过 Alamar-Blue 染色的荧光强度测试 EC50 值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 雌性无胸腺 NMRI-nu/nu 鼠</p> <p>Formulation: 溶于 0.5%羟乙基纤维素溶液中</p> <p>Dosages: 100 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</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。