



尼达尼布

溶解性数据:

体外实验:

DMSO : 5.83 mg/mL (10.80 mM; ultrasonic and warming and heat to 60°C)

H₂O : < 0.1 mg/mL (ultrasonic;warming;heat to 60°C) (insoluble)

制备储备液	Concentration	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

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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。

体内实验:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂： 1% CMC/0.5% Tween-80 in Saline water

Solubility: 10 mg/mL (18.53 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

2.请依序添加每种溶剂： 50% PEG300→50% saline

Solubility: 10 mg/mL (18.53 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

BIOLOGICAL ACTIVITY:

生物活性:



Nintedanib (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 的 IC₅₀ 值分别为 34 nM/13 nM/13 nM，69 nM/37 nM/108 nM 和 59 nM/65 nM。

IC₅₀ & Target VEGFR1:

34 nM (IC₅₀)

VEGFR2

13 nM (IC₅₀)

VEGFR3

13 nM (IC₅₀)

FGFR1

69 nM (IC₅₀)

FGFR2

37 nM (IC₅₀)

FGFR3

108 nM (IC₅₀)

PDGFR α

59 nM (IC₅₀)

PDGFR β

65 nM (IC₅₀)



体外研究:

Nintedanib 与激酶结构域氨基末端和羧基末端裂片之间的裂隙中的 ATP 结合位点结合。Nintedanib 抑制 PDGF-BB 刺激的 BRP 增殖，细胞测定中的 EC₅₀ 为 79 nM。Nintedanib (100 nM) 在用 5% 血清加 PDGF-BB 刺激后阻断 MAPK 的激活。Nintedanib 可阻止 PDGF-BB 刺激的增殖，在人血管平滑肌细胞 (HUASMC) 培养物中的 EC₅₀ 为 69 nM。

体内研究:



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 400-666-5481 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: 3008007435@qq.com

Nintedanib（每日口服 25-100 mg/kg）在所有肿瘤模型中均具有高活性，包括在裸鼠体内生长的人类肿瘤异种移植瘤和同源大鼠肿瘤模型。这在 3 天后的肿瘤灌注磁共振成像中很明显，5 天后血管密度和血管完整性降低，生长抑制显著。

Nintedanib 可口服，在体内肿瘤模型中表现出令人鼓舞的疗效，同时耐受性良好。

