



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

产品名称: **BIBF0775**
CAS 号: **334951-90-5**
产品货号: **S88655**

生物活性:

Description	BIBF0775 是有效, 选择性的 TGFβI 型受体 (Alk5)的抑制剂, IC50 为 34 nM。			
IC50 & Target	IC50: 34 nM (Alk5)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HUVEC	EC ₅₀	718 nM	Antiangiogenic activity in HUVEC assessed as inhibition of VEGF-induced cell proliferation by [3H]thymidine incorporation assay
	HaCaT	EC ₅₀	105 nM	Inhibition of TGFβeta receptor in human HaCaT cells assessed as Smad phosphorylation by ELISA
	HaCaT	IC ₅₀	> 1 μM	Cytotoxicity against human HaCaT cells
	Sf9	IC ₅₀	1447 nM	Inhibition of human VEGFR2 expressed in Sf9 cells
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 62.5 mg/mL (126.36 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
			1 mg	5 mg
				10 mg
		1 mM	2.0217 mL	10.1086 mL
		5 mM	0.4043 mL	2.0217 mL
		10 mM	0.2022 mL	1.0109 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二			



	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Roth GJ, et al. Design, synthesis, and evaluation of indolinones as inhibitors of the transforming growth factor β receptor I (TGFβRI). J Med Chem. 2010 Oct 28;53(20):7287-95.

完整储备液配制表:

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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.0217 mL	10.1086 mL	20.2171 mL	50.5428 mL
	5 mM	0.4043 mL	2.0217 mL	4.0434 mL	10.1086 mL
	10 mM	0.2022 mL	1.0109 mL	2.0217 mL	5.0543 mL
	15 mM	0.1348 mL	0.6739 mL	1.3478 mL	3.3695 mL
	20 mM	0.1011 mL	0.5054 mL	1.0109 mL	2.5271 mL
	25 mM	0.0809 mL	0.4043 mL	0.8087 mL	2.0217 mL
	30 mM	0.0674 mL	0.3370 mL	0.6739 mL	1.6848 mL
	40 mM	0.0505 mL	0.2527 mL	0.5054 mL	1.2636 mL
	50 mM	0.0404 mL	0.2022 mL	0.4043 mL	1.0109 mL
	60 mM	0.0337 mL	0.1685 mL	0.3370 mL	0.8424 mL
	80 mM	0.0253 mL	0.1264 mL	0.2527 mL	0.6318 mL
	100 mM	0.0202 mL	0.1011 mL	0.2022 mL	0.5054 mL