

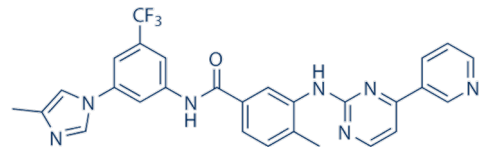
Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|------------------------|------------|
| SC0209-10mM | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC0209-5mg | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 5mg |
| SC0209-25mg | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|--|
| 化学名 | 4-methyl-N-[3-(4-methylimidazol-1-yl)-5-(trifluoromethyl)phenyl]-3-[(4-pyridin-3-yl)pyrimidin-2-yl]amino]benzamide |
| 简称 | Nilotinib |
| 别名 | AMN-107, AMN 107, AMN107, Tasigna, 尼罗替尼 |
| 中文名 | 尼洛替尼 |
| 化学式 | C ₂₈ H ₂₂ F ₃ N ₇ O |
| 分子量 | 529.52 |
| CAS号 | 641571-10-0 |
| 纯度 | 99.8% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 27mg/ml; Ethanol <1mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入0.94ml DMSO, 或每5.3mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0209-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------|--|---|---|---|---|
| 产品描述 | Nilotinib(AMN-107)是一种Bcr-Abl抑制剂, 在小鼠骨髓祖细胞中IC50低于30nM。 | | | | |
| 信号通路 | Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad | | | | |
| 靶点 | Bcr-Abl | — | — | — | — |
| IC50 | <30nM | — | — | — | — |
| 体外研究 | Nilotinib作用于激活的HSCs, 抑制增殖、迁移和肌动蛋白形成, 及α-SMA和胶原的表达。Nilotinib诱导HSCs凋亡, 与bcl-2表达降低相关, 且提高p53表达、PARP分裂以及提高PPARγ和TRAIL-R表达。Nilotinib也诱导细胞周期停滞, 伴随着p27的表达和cyclin D1的下调提高。Nilotinib不仅抑制PDGFR的激活, 也通过Src抑制TGFRII。Nilotinib显著抑制PDGF和TGFβ刺激的ERK和Akt磷酸化。而且, Nilotinib作用于人HSCs, 抑制PDGF和TGFβ-激活的Abl磷酸化形式。Nilotinib抑制最抗Imatinib的BCR-ABL突变, 除了T315I。Nilotinib抑制PDGF-DD调节的ERK1/2激活, 基本的和PDGF-DD调节的PDGFR-β和AKT激活, 及schwannoma细胞增殖。Nilotinib比Imatinib更有效, 发挥其最大抑制效果时的浓度比稳态血浆水平还低。Nilotinib也显著降低TGF-β1和血小板衍生的生长因子(PDGF)基因表达水平。Nilotinib处理也显著抑制PDGF诱导的肺纤维细胞增殖。 | | | | |
| 体内研究 | Nilotinib作用于CC14和BDL诱导的纤维化, 降低胶原沉积和α-SMA表达。Nilotinib可以诱导HSC发生凋亡, 与bcl-2的下调相关。Nilotinib轻肺损伤和纤维化程度。Nilotinib疗法在第14天和21天, 显著降低羟脯氨酸水平, 伴随着转化生长因子(TGF)-β1和PDGFR-β表达水平降低。 | | | | |
| 临床实验 | N/A | | | | |
| 特征 | Nilotinib是Abl选择性抑制剂, 与BCR-ABL的ATP结合位点相互作用。 | | | | |

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

| 酶活性检测实验 | |
|---------|-----|
| 方法 | N/A |

| 细胞实验 | |
|------|---|
| 细胞系 | 人类原代Schwann和Schwannoma细胞 |
| 浓度 | 1μM-10μM |
| 处理时间 | 72小时 |
| 方法 | 人类原代Schwann和Schwannoma细胞接种在预包被的96孔板上。加入Nilotinib, 40分钟后, 使用100ng/ml |

| | |
|--|--|
| | PDGF-DD刺激处理, 细胞培养72小时(3天)。因为Nilotinib的半衰期为18小时, 每天新鲜补充的浓度为最初加入浓度的一半。除了DAPI染色和测定全部细胞数外, 使用更敏感和准确的BrdU渗透法测定增殖细胞。使用倒置荧光显微镜和200×放大倍率。计算全部细胞数(DAPI)和分裂细胞数(BrdU阳性)。计数每孔中的所有细胞。每孔中不同批次细胞的全部细胞数不同。 |
|--|--|

| 动物实验 | |
|------|----------------------------|
| 动物模型 | 雄性6周大的C57BL6小鼠 |
| 配制 | 10% NMP-90% PEG300, PEG300 |
| 剂量 | 100mg/kg |
| 给药方式 | 口服饲喂 |

➤ **参考文献:**

1. Weisberg E, et al. Cancer Cell. 2005; 7(2):129-141.
2. Weisberg E, et al. Blood. 2007; 109(5):2112-2120.
3. Liu Y, et al. J Hepatol. 2011; 55(3):612-625.
4. Hochhaus A, et al. Cell Cycle. 2011; 10(2):250-260.
5. Ammoun S, et al. Neuro Oncol. 2011; 13(7):759-766.
6. Rhee CK, et al. Respiration. 2011; 82(3):273-287.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|------------------------|------------|
| SC0209-10mM | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC0209-5mg | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 5mg |
| SC0209-25mg | Nilotinib (Bcr-Abl抑制剂) | 25mg |
| — | 说明书 | 1份 |

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09