

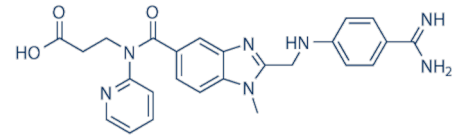
Dabigatran (Thrombin抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1073-1mM	Dabigatran (Thrombin抑制剂)	1mM×2ml
SF1073-5mg	Dabigatran (Thrombin抑制剂)	5mg
SF1073-25mg	Dabigatran (Thrombin抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-[[2-[(4-carbamimidoylanilino)methyl]-1-methylbenzimidazole-5-carbonyl]-pyridin-2-ylamino]propanoic acid
简称	Dabigatran
别名	BIBR 953, BIBR 1048, Dabigatran etexilate, Dabigatran etexilate mesylate, Pradaxa, BIBR953, BIBR-953
中文名	达比加群
化学式	C ₂₅ H ₂₅ N ₇ O ₃
分子量	471.51
CAS号	211914-51-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water -DMSO 0.5mg/ml; Ethanol 0.01mg/ml
溶液配制	5mg加入10.6ml DMSO, 或每4.72mg加入10ml DMSO, 配制成1mM溶液。SF1073-1mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Dabigatran (BIBR 953)是一种有效的非肽类凝血酶抑制剂, 无细胞试验中IC ₅₀ 为9.3nM。				
信号通路	Others				
靶点	Thrombin	—	—	—	—
IC ₅₀	9.3nM	—	—	—	—
体外研究	BIBR953是一种非常有效的抗凝血剂。BIBR 953显示出其终端苯基能够被亲水性更强的2-吡啶基取代, 而活性不会过多损失。BIBR953抑制凝血酶、纤溶酶、凝血因子Xa、胰蛋白酶、tPA和活化的蛋白质C, K _i 分别为4.5nM、1.7μM、3.8μM、50nM、45μM和20μM。BIBR953特异性可逆抑制凝血酶。				
体内研究	BIBR953对大鼠i.v.给药后, 表现出最有效的活性。Dabigatran etexilate口服给药后, dabigatran的生物利用度为7.2%。Dabigatran口服治疗后主要通过粪便排泄, 静脉注射后主要通过尿液排泄。Dabigatran的平均终末半衰期大约为8小时。口服和静脉注射给药后, Dabigatran酰基葡萄糖苷酸分别占0.4%和4%。				
临床实验	N/A				
特征	Dabigatran是一种可逆的, 竞争性的, 直接的凝血酶抑制剂。				

➤ 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	BIBR953的凝血酶抑制作用(IC ₅₀)通过市售显色分析试剂测定。人凝血酶(0.042U/ml)与不同浓度BIBR 953在DMSO中的稀释液(浓度范围为0.003μM-100μM)或对照组DMSO于37°C下预培养10分钟。将预培养混合物加入显色底物, 甲苯磺酰基-甘氨酸-脯氨酸-精氨酸-4-硝基苯胺乙酸中, 底物被凝血酶裂解, 由于游离的硝基苯胺, 405nm下的吸光度增加, 在分光光度计上测量增加的吸光度。以405nm下的吸光度对BIBR 953的浓度作图, 计算抑制50%凝血酶(IC ₅₀)的BIBR 953浓度。所有测量均重复两份进行, 以两个测定的平均值来表示最终结果。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A

方法	N/A
----	-----

动物实验	
动物模型	大鼠
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	静脉注射给药

➤ **参考文献:**

- 1.Huel NH, et al. J Med Chem. 2002, 45(9), 1757-1766.
- 2.Stangier J, et al. Br J Clin Pharmacol. 2007, 64(3), 292-303.
- 3.Blech S, et al. Drug Metab Dispos. 2008, 36(2), 386-399.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF1073-1mM	Dabigatran (Thrombin抑制剂)	1mM×2ml
SF1073-5mg	Dabigatran (Thrombin抑制剂)	5mg
SF1073-25mg	Dabigatran (Thrombin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淀至管底后再开盖使用。
2. 对于1mM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、体内研究结果或其他相关文献，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 2017.11.01