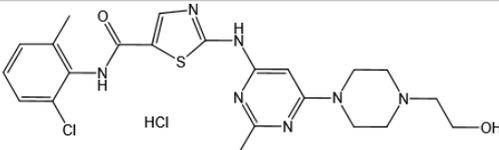


Dasatinib hydrochloride

产品简介

Dasatinib hydrochloride, 又称达沙替尼盐酸盐, 是可口服的、ATP 竞争性的 Src/Abl 双抑制剂。Dasatinib 可诱导细胞自噬和细胞凋亡并具有抗肿瘤活性。Dasatinib 对血液和实体瘤细胞表现出非常强的抗增殖活性, 并在 CML 移植瘤动物模型中表现出完全的肿瘤消退和低毒性特性。在表达野生型 Bcr-Abl 的细胞系中, Dasatinib 比伊马替尼(imatinib)的活性高 325 倍(IC₅₀: 0.6 versus 280 nM)。

产品信息

英文别名 (English Synonym)	Dasatinib hydrochloride, Dasatinib HCl, BMS-354825 HCl, BMS354825 HCl, BMS-354825 hydrochloride, BMS354825 hydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	达沙替尼盐酸盐, 盐酸达沙替尼
靶点 (Target)	Src/Abl, c-Kit
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--Bcr-Abl
CAS 号 (CAS NO.)	854001-07-3
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₂₇ Cl ₂ N ₇ O ₂ S
分子量 (Molecular Weight)	524.47
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO 和 H ₂ O
结构式 (Structure)	

组分信息

组分名称	54663ES50/54663ES70
Dasatinib hydrochloride	50 mg/200 mg

储存条件

-25~-15°C保存, 有效期 3 年。

使用方法

【数据来自于公开发表的文献, 仅供参考, 具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

1、细胞实验 (体外实验)

BMS-354825 在表达野生型 Bcr-Abl 的 Ba/F3 细胞系中比伊马替尼的抑制活性高 325 倍(IC₅₀: 0.8 nM versus 260 nM); 所有耐伊马替尼的突变型细胞中 BMS-354825 具有相似的抑制能力(IC₅₀: 0.8-11 nM), 除了 T315I 突变型抑制效率非常低 (IC₅₀

>200 nM)。^[1]

2、动物实验（体内实验）

在 K562 移植瘤小鼠模型中，口服 BMS-354825 (5 or 50 mg/kg)表现出强大的抗肿瘤活性和低毒性。^[2]

注意事项

1. 本产品仅作科研用途。
2. 为了您的安全和健康，请穿实验服并佩戴一次性手套操作。
3. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
4. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。

参考文献

[1] O'Hare T, Walters DK, Stoffregen EP, et al. In vitro activity of Bcr-Abl inhibitors AMN107 and BMS-354825 against clinically relevant imatinib-resistant Abl kinase domain mutants. *Cancer Res.* 2005 Jun 1;65(11):4500-5. doi: 10.1158/0008-5472.IF:8.378).

[2] Lombardo LJ, Lee FY, Chen P, et al. Discovery of N-(2-chloro-6-methyl- phenyl)-2-(6-(4-(2-hydroxyethyl)-piperazin-1-yl)-2-methylpyrimidin-4-ylamino)thiazole-5-carboxamide (BMS-354825), a dual Src/Abl kinase inhibitor with potent antitumor activity in preclinical assays. *J Med Chem.* 2004 Dec 30;47(27):6658-61. doi: 10.1021/jm049486a(IF:6.054).