

Lestaurtinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Lestaurtinib	53224ES03	1 mg
	53224ES08	5 mg

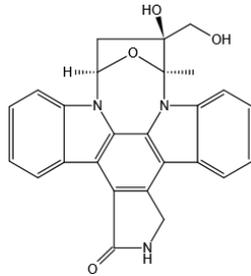
产品描述

Lestaurtinib (CEP-701, KT-5555)是一种 ATP 竞争性的多激酶抑制剂, 对 Trk 受体酪氨酸激酶家族具有强大的活性。Lestaurtinib 抑制 JAK2, FLT3 和 TrkA 的 IC₅₀ 分别为 0.9 nM, 3 nM 和 < 25 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Lestaurtinib, CEP-701, KT-5555
中文名称 (Chinese Name)	来他替尼
靶点 (Target)	JAK2, FLT3, TrkA
通路 (Pathway)	Epigenetics
CAS 号 (CAS NO.)	111358-88-4
分子式 (Formula)	C ₂₆ H ₂₁ N ₃ O ₄
分子量 (Molecular Weight)	439.46
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO ≥50 mg/mL

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

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

使用浓度

【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。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

（一）细胞实验（体外实验）

Lestaurtinib 增强 TRAIL 诱导的胶质瘤细胞(U87, U251)增殖抑制作用和促细胞凋亡作用。^[1] Lestaurtinib (10-500 nM)在 SY5Y-TrkB 神经母细胞瘤系中抑制外源性 BDNF 诱导的 TrkB 磷酸化。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在胶质瘤移植瘤小鼠（WT 和 DR5 -KO U87）模型中，腹腔注射 Lestaurtinib (10 mg/kg)和 TRAIL (100 μg/小鼠)，显著抑制肿瘤生长，但 DR5 -KO 肿瘤对联合治疗不敏感。^[1] 在 SY5Y-TrkB 神经母细胞瘤移植瘤小鼠模型中，腹腔注射 Lestaurtinib (20 mg/kg)，显著抑制瘤体生长，并且增强了 topotecan 联合 cyclophosphamide 或 irinotecan 联合 temozolomide 的抗肿瘤功效。^[2]

参考文献

- [1]. Cao YX, et al. Lestaurtinib potentiates TRAIL-induced apoptosis in glioma via CHOP-dependent DR5 induction. *J Cell Mol Med.* 2020 Jul;24(14):7829-7840.
- [2]. Iyer R, et al. Lestaurtinib enhances the antitumor efficacy of chemotherapy in murine xenograft models of neuroblastoma. *Clin Cancer Res.* 2010 Mar 1;16(5):1478-85.