

## Bosutinib 伯舒替尼

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Bosutinib 伯舒替尼	53267ES10	10 mg
	53267ES50	50 mg
	53267ES60	100 mg
	53267ES72	250 mg

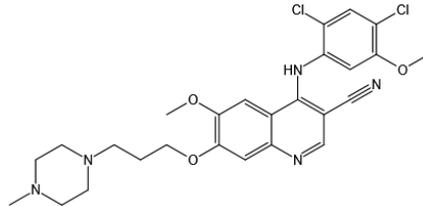
### 产品描述

Bosutinib (SKI-606, SKI606), 也称伯舒替尼, 是一种新型的双重酪氨酸激酶 Src/Abl 抑制剂, IC<sub>50</sub> 分别为 1.2 nM 和 1 nM, 表现出抗癌活性, 常用于治疗慢性粒细胞性白血病(CML)。此外, Bosutinib 能促进自噬, 抑制 ERK 和 STAT3 的磷酸化。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Bosutinib, SKI-606, SKI606
中文名称 (Chinese Name)	伯舒替尼
靶点 (Target)	Src, Abl
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--Src
CAS 号 (CAS NO.)	380843-75-4
分子式 (Formula)	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>
分子量 (Molecular Weight)	530.45
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 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 3 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）

Bosutinib 显著抑制 Bcr-Abl 阳性白血病细胞系 KU812、K562 和 MEG-01 的增殖， $IC_{50}$  分别为 5 nM、20 nM 和 20 nM。

<sup>[2]</sup> Bosutinib 不影响乳腺癌细胞增殖，但可明显降低乳腺癌细胞的迁移和侵袭能力， $IC_{50}$  为 250 nM。<sup>[3]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在 Src-转化纤维移植瘤和 HT29 移植瘤的裸鼠模型中，Bosutinib 可有效抑制异种移植模型中的肿瘤生长。<sup>[1]</sup> 在白血病 K562 移植瘤小鼠模型中，口服 Bosutinib (150 mg/kg) 可除去肿瘤，且没有毒性。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Boschelli DH, et al. Optimization of 4-phenylamino-3-quinolinecarbonitriles as potent inhibitors of Src kinase activity. *J Med Chem.* 2001 Nov 8;44(23):3965-77.
- [2]. Golas JM, et al. SKI-606, a 4-anilino-3-quinolinecarbonitrile dual inhibitor of Src and Abl kinases, is a potent antiproliferative agent against chronic myelogenous leukemia cells in culture and causes regression of K562 xenografts in nude mice. *Cancer Res.* 2003 Jan 15;63(2):375-81.
- [3]. Vultur A, et al. SKI-606 (bosutinib), a novel Src kinase inhibitor, suppresses migration and invasion of human breast cancer cells. *Mol Cancer Ther.* 2008 May;7(5):1185-94.