

HB220112

Dasatinib(BMS-354825;达沙替尼)

产品信息

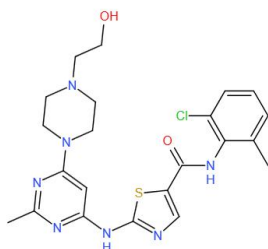
产品名称	产品编号	规格
Dasatinib(BMS-354825;达沙替尼)	52611ES25	25 mg
	52611ES60	100 mg

产品描述

Dasatinib(BMS-354825)是一种口服有效、ATP 竞争性和高效的 Src/Abl 双抑制剂，作用于纯化激酶的 IC₅₀ 值分别是 0.55 nM 和 3.0 nM。Dasatinib 可诱导细胞自噬和细胞凋亡并具有抗肿瘤的活性。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)。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	BMS-354825; Sprycel; BMS354825; BMS 354825
中文名称 (Chinese Name)	达沙替尼; 扑瑞赛
靶点 (Target)	Abl; Src; c-Kit
CAS 号 (CAS NO.)	302962-49-8
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₂₆ ClN ₇ O ₂ S
分子量 (Molecular Weight)	488.01
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥24.4 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。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存，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) 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）

为了验证达沙替尼（BMS-354825）对细胞增殖的抑制活性，以稳定表达野生型 Bcr-Abl 或者激酶结构域突变型 Bcr-Abl 的 Ba/F3 细胞系为研究对象，分别加入递增量的伊马替尼或 BMS-354825 作用 72 h，基于硫甲磺酸酯的细胞活力实验结果显示，野生型表达细胞中 BMS-354825 比伊马替尼的抑制活性高 325 倍 (IC_{50} : 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 (IC_{50} : 0.8-11 nM)，除了 T315I 突变型抑制效率非常低 (IC_{50} > 200 nM)。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

为了研究 BMS-354825 体内对 Bcr-Abl 的抑制活性，以接种 Ba/F3 细胞的 SCID 小鼠为研究模型，在接种细胞 3 天后给动物口服 BMS-354825 (10 mg/kg，一天 2 次)，持续作用 2 周后，给动物注射荧光素酶底物 luciferin，体内成像结果显示溶剂处理组动物发展成进展性疾病，相反，接种正常表达 BCR-ABL 或临床常见耐伊马替尼 BCR-ABL M351T 突变型细胞的动物经 BMS-354825 治疗后表现很健康，没有出现体重减少，昏睡或皮毛起皱等病症。2 周处理后生物化学发光活性至少降低 1 个数量级。^[1]

参考文献

[1]. O'Hare T, 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.