

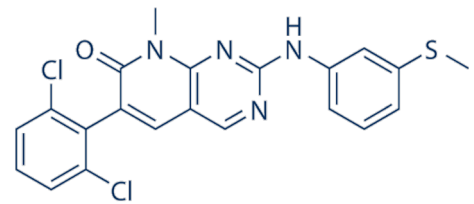
PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1063-10mM	PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1063-5mg	PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1063-25mg	PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-(2,6-dichlorophenyl)-8-methyl-2-(3-methylsulfanylanilino)pyrido[2,3-d]pyrimidin-7-one
简称	PD-173955
别名	PD 173955, PD173955
中文名	N/A
化学式	C ₂₁ H ₁₆ Cl ₂ N ₄ OS
分子量	443.35
CAS号	260415-63-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 15mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.13ml DMSO, 或每4.43mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1063-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	PD173955是一种强效的Bcr-Abl抑制剂, IC50为1-2nM, 同时也可抑制Src活性, IC50为22nM。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad				
靶点	Bcr-Abl	Src	—	—	—
IC50	1nM-2nM	22nM	—	—	—
体外研究	PD173955有效抑制Bcr-Abl依赖性细胞生长, 在Bcr-Abl 阳性细胞系中IC50为2-35nM, 比Bcr-Abl阴性细胞系敏感100到200倍。PD173955也会抑制试剂盒配体依赖性M07e细胞增殖, IC50为40nM, 通过抑制试剂盒配体依赖性c-kit自身磷酸化。此外, PD173955, 作为Src抑制剂, 在各类型细胞早期有丝分裂期间有效抑制有丝分裂进程, 并诱导不同程度的细胞凋亡。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	在维持对数期培养条件下, Bcr-Abl联合SHIP2从K562细胞裂解物中免疫沉淀。复合物在蛋白质A-琼脂糖上被收集, 并且在裂解缓冲液中清洗3次, 然后在abl激酶缓冲液[50mM Tris(pH 8.0), 10mM MgCl ₂ , 1mM DTT, 2mM对硝基苯酚磷酸盐和2μM ATP; 新英格兰生物实验室缓冲液和方案]中清洗2次。在指示浓度的药物存在或不存在下, 激酶试验用10μM[γ-32P]ATP/样品在30°C下进行15到60分钟。加入SDS-PAGE样品缓冲液并在100°C下加热10分钟停止反应。蛋白质在7.5% SDS聚丙烯酰胺凝胶上分离, 凝胶在真空中干燥, 磷酸化过程通过X-ray胶片的放射自显影可视化。

细胞实验	
细胞系	Bcr-Abl阳性细胞系(R10(+), R10(-), K562和RWLeu4); Bcr-Abl阴性细胞系(HL-60、SK-N-ER、SK-N-MC、U138MG和HS-16)
浓度	10μM
处理时间	48小时
方法	细胞生长通过两种方法确定。对于 ³ H胸苷测定, 细胞(10 ⁴ 细胞/孔)接种于96孔圆底平板, 在DMSO(对照), 或悬浮于DMSO中的不同浓度特定化合物于37°C培养48小时。 ³ H胸苷以1μCi/孔的浓度加入,

	细胞再培育18小时。用Unifilter系统采集细胞，将闪烁液(25微升/孔)加入每孔， ³ H胸苷的整合通过Packard闪烁计数器测定。所有测定的数据点重复得到3份，确定无细胞孔中的背景整合，并从所有数据点中减去。对于细胞活性，采集的对照组和药物处理过的细胞使用台盼蓝染色排除法在血细胞计数器上计数。
--	---

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Wisniewski D, et al. Cancer Res. 2002, 62(15), 4244-4255.
2. MoassermM, et al. Cancer Res. 1999, 59(24), 6145-6152.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1063-10mM	PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1063-5mg	PD-173955 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1063-25mg	PD-173955 (Bcr-Abl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:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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10mM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