

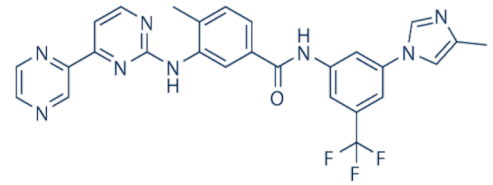
## Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1067-10mM	Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1067-5mg	Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1067-25mg	Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-methyl-N-[3-(4-methylimidazol-1-yl)-5-(trifluoromethyl)phenyl]-3-[(4-pyrazin-2-yl)pyrimidin-2-yl]amino]benzamide
简称	Radotinib
别名	IY5511, IY 5511, IY-5511, IY5511HCl,
中文名	拉多替尼
化学式	C <sub>27</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>8</sub> O
分子量	530.5
CAS号	926037-48-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.94ml DMSO, 或每5.31mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1067-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Radotinib是一种选择性BCR-ABL1酪氨酸激酶抑制剂, IC50为34nM, 用于治疗慢性髓性白血病。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad				
靶点	BCR-ABL1	—	—	—	—
IC50	34nM	—	—	—	—
体外研究	在体外, Radotinib结合到BCR-ABL1, 并减少一个BCR-ABL1靶蛋白, CrkL的磷酸化。Radotinib也会有效抑制BCR-ABL1的正常突变克隆珠的增殖, 而对T315I没有影响。在Aml细胞中, radotinib显著降低细胞活性, 促进分化, 并诱导CD11b表达和凋亡。在NB4、THP-1和Kasumi-1细胞中, radotinib也会诱导CD11b表达, 并降低活性。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	Aml和Cml患者的BMCs、NB4、HL60、KASUMI-1和THP-1细胞
浓度	~100μM
处理时间	72小时
方法	细胞以2×10 <sup>4</sup> 细胞/ml与100μl/孔的培养基接种到96孔板, 然后与不同浓度radotinib(0、1、10和100μM)在37°C下培育72小时。CellTiter 96溶液(20μl)直接加入每个孔中, 板在37°C, 潮湿的5% CO <sub>2</sub> 大气环境中培育4小时。吸光度使用PowerWave XS2微孔板分光光度计在490nm下测量, 结果表示为相对于基础状态的变化百分比, 每个实验处理使用4到5个培养孔。在一些实验中, HL60细胞与100nM ATRA和1μM dasatinib培育4天, 并根据计划表将10μM radotinib加入每组。

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.Kim SH, et al. Haematologica. 2014, 99(7), 1191-1196.
- 2.Heo SK, et al. PLoS One. 2015, 10(6):e0129853.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1067-10mM	Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1067-5mg	Radotinib (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1067-25mg	Radotinib (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:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效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