

GZD824 Dimesylate

产品编号: D50370

CAS: 1421783-64-3

保存条件: Store at -20°C for 3 year(Powder); In DMSO or others solvent store at 2-4°C for two weeks, at -20°C for six months.

产品介绍: **基本信息:**

CAS: 1421783-64-3

分子式: $C_{29}H_{27}F_3N_6O \cdot 2CH_4O_3S$

分子量: 724.77

纯度: 98%

外观: 白色粉末

溶解性: 溶于水(100mg/ml); DMSO(100mg/ml);

配制方法: 5mg加入0.69ml DMSO, 或者每7.25mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。

产品简介:

作用靶点: BCR-ABL1;

作用通路: Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad;

GZD824 Dimesylate是新型口服有效的Bcr-Abl抑制剂, 作用于Bcr-Abl(WT)和Bcr-Abl(T315I), IC50分别为0.34nM和0.68nM。

体外研究:

产品描述: GZD824有效抑制了表达有野生型BCR-ABLBa/F3细胞的生长, IC50为1.0nM。与生化激酶抑制和蛋白质结合亲和力实验结果高度相符, GZD824也强烈抑制表达的Bcr-Abl (T315I) 突变体的Ba/F3细胞和14种抗性相关的BCR-ABL突变株的增殖。此外, 在K562白血病细胞中, GZD824有效地以浓度依赖性的方式抑制BCR-ABL以及下游CRKL和STAT5的激活。

体内研究:

在K562肿瘤异种移植和KU812异种移植模型中, GZD824 (5和10毫克/公斤/天) 剂量依赖性地抑制了肿瘤的生长, 并且没有死亡或损失体重。此外, 在表达的Bcr-Abl WT和BCR-Abl (T315I) 的Ba/F3细胞的同种异体移植小鼠中, GZD824 (20毫克/千克/天) 抑制肿瘤生长。