www.bioss.com.cn
sales@bioss.com.cn
techsupport@bioss.com.cn
400-901-9800

DCC-2036 (Rebastinib)

产品编号： D50374

CAS: 1020172-07-9

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：1020172-07-9

分子式：C30H28FN7O3

分子量：553.59

纯度：99%

溶解性：溶于乙醇：13 mg/mL (23.5 mM)；DMSO：103 mg/mL (186.1 mM)

作用靶点：BCR-ABL1;

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

用途/描述：DCC-2036 (Rebastinib) 是一种Bcr-Abl抑制剂，作用于Abl1(WT)和Abl1(T315I)，IC50分别为0.8 nM和4 nM，也抑制SRC， LYN， FGR， HCK， KDR， FLT3，和Tie-2，对c-Kit具有低的抑制活性。

体外研究：

DCC-2036有效抑制纯化的未磷酸化(u-ABL1^{native}) 和磷酸化(p-ABL1^{native})ABL1, 未磷酸化和磷酸化突变型ABL1^{T315I}，及激活环突变ABL1^{H396P}，这种作用为非ATP竞争性的，IC50分别为0.8nM, 2nM, 1.4nM, 5nM, 和4nM。而且，DCC-2036也抑制SRC家族激酶SRC, LYN, FGR, 和HCK, 和受体TKsKDR, FLT3, 和TIE2，IC50分别为34nM, 29nM, 38nM, 40nM, 4nM, 2nM和6nM。DCC-2036作用于表达野生型或突变型BCR-ABL1的Ba/F3细胞，具有抗增殖活性，IC50为2nM到150nM。此外，DCC-2036也抑制Ph+细胞系K562(IC505.5nM)增殖，且有效诱导表达BCR-ABL1的Ba/F3和K562细胞凋亡。最新研究显示DCC-2036通过显著抑制CML细胞系（与非CML白血病细胞系相比），而选择性抑制BCR-ABL阳性细胞。

体内研究：

DCC-2036每天按100 mg/kg剂量口服饲喂给药携带Ba/F3-BCR-ABL1T315I白血病细胞的小鼠移植瘤模型，每天一次，有效抑制BCR-ABL1信号，且显著延长小鼠寿命。

Important Note: This product as supplied is intended for research use only, not for use in human, therapeutic or diagnostic applications.