

## PD-173955 ; PD173955

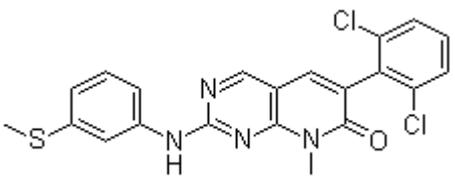
产品编号 : MB3959

质量标准 : >98% , Bcr-Abl 的活性抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C21H16Cl2N4OS	结 构 式	
分子量	443.35		
CAS No.	260415-63-2		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 15 mg/mL warmed (33.83 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介 :** PD173955 是一种强效的 Bcr-Abl 抑制剂, 同时也可抑制 Src 活性。

**别名 :** Pyrido[2,3-d]pyrimidin-7(8H)-one, 6-(2,6-dichlorophenyl)-8-methyl-2-[[3-(methylthio)phenyl]amino]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....类白色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 15 mg/mL warmed (33.83 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	PD173955 是一种强效的 Bcr-Abl 抑制剂, IC50 为 1-2 nM,同时也可抑制 Src 活性, IC50 为 22 nM。					
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>Bcr-Abl</td> <td>Src</td> </tr> <tr> <td>1 nM-2 nM</td> <td>22 nM</td> </tr> </table>	Bcr-Abl	Src	1 nM-2 nM	22 nM	
Bcr-Abl	Src					
1 nM-2 nM	22 nM					

<b>体外研究</b>	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 2-35 nM，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 40 nM，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。
-------------	---

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB3919	Bafetinib (INNO-406)
MB3956	DCC-2036 (Rebastinib)
MB3957	GNF-2

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。PD173955 是一种强效的 Bcr-Abl 抑制剂，同时也可抑制 Src 活性，本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2556 mL	11.2778 mL	22.5555 mL
5 mM	0.4511 mL	2.2556 mL	4.5111 mL
10 mM	0.2256 mL	1.1278 mL	2.2556 mL
50 mM	-	-	-

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>体外 Bcr-Abl 激酶试验:</b> 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[50 mM Tris (pH 8.0)，10 mM MgCl<sub>2</sub>，1 mM DTT，2 mM 对硝基苯酚磷酸盐，和 2 μM 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 10 μM [γ-<sup>32</sup>P]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，凝胶在真空下干燥，磷酸化过程通过 X-ray 胶片的放射自显影可视化。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 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) <b>Concentrations:</b> 10 μM <b>Incubation Time:</b> 48 小时 <b>Method:</b> 细胞生长通过两种方法确定。对于 [<sup>3</sup>H] 胸苷测定，细胞(10<sup>4</sup> 细胞/孔)接种于 96 孔圆底</p>

平板，在 DMSO(对照)，或悬浮于 DMSO 中的不同浓度特定化合物下于 37°C 培养 48 小时。<sup>[3H]</sup> 胸苷以 1 μCi/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，<sup>[3H]</sup> 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。

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

**活性化合物操作注意事项**

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表  
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8

大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。