

Cerdulatinib hydrochloride

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Cerdulatinib hydrochloride	53512ES08	5 mg
	53512ES25	25 mg

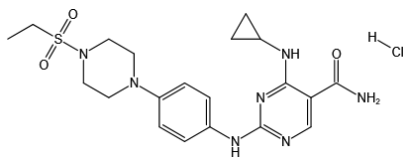
产品描述

Cerdulatinib hydrochloride (PRT-062070 hydrochloride, PRT062070 hydrochloride, PRT2070 hydrochloride, PRT-2070 hydrochloride), 又称 Cerdulatinib 盐酸盐, 是一种选择性、具有口服活性和可逆的 ATP 竞争性的多靶点酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 JAK1/2/3、SYK、Tyk2 的 IC_{50} 值分别为 12 nM、6 nM、8 nM、32 nM、0.5 nM; 还抑制 19 种其他激酶, IC_{50} 小于 200 nM。cerdulatinib 在多种恶性肿瘤中已表现出广泛的临床活性, 并且也可用于自身免疫性疾病。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Cerdulatinib hydrochloride, PRT-062070 hydrochloride, PRT062070 hydrochloride, PRT2070 hydrochloride, PRT-2070 hydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	Cerdulatinib 盐酸盐
靶点 (Target)	SYK, Tyk2, JAK1/2/3
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase/RTK--Syk
CAS 号 (CAS NO.)	1369761-01-2
分子式 (Formula)	$C_{20}H_{28}ClN_7O_3S$
分子量 (Molecular Weight)	482
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C , 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

（一）细胞实验（体外实验）

Cerdulatinib (0.03-4 μM)抑制 ERK Y204 磷酸化, IC_{50} 为 0.5 μM , 降低了人类全血 B 细胞中上调早期激活标记物 CD69 细胞表面表达的能力。Cerdulatinib (0.015-2 μM)抑制 Fc ϵ RI 介导的嗜碱性粒细胞脱颗粒, IC_{50} 为 0.12 μM 。Cerdulatinib (1-3 μM) 诱导 BCR 信号转导的非霍奇金淋巴瘤(NHL)细胞凋亡。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

在大鼠胶原诱导的关节炎模型中, Cerdulatinib (5 mg/kg p.o.)显著改善滑膜的炎性浸润和关节软骨的完整性。此外, Cerdulatinib 也会阻断小鼠体内 BCR 诱导的 B 细胞活化和脾肿大。^[1]

参考文献

- [1]. Coffey G, et al. The novel kinase inhibitor PRT062070 (Cerdulatinib) demonstrates efficacy in models of autoimmunity and B-cell cancer. J Pharmacol Exp Ther. 2014 Dec; 351(3): 538-48.
- [2]. Ishikawa C, et, al. Anti-adult T-cell leukemia/lymphoma activity of cerdulatinib, a dual SYK/JAK kinase inhibitor. Int J Oncol. 2018 Oct; 53(4): 1681-1690.