



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Radotinib(IY-5511)**
CAS 号: **926037-48-1**
产品货号: **S88798**

生物活性:

Description	Radotinib (IY-5511) 是一种口服有效且能透过血脑屏障的选择性酪氨酸激酶 Bcr-Abl1 抑制剂，IC50 为 34 nM。Radotinib 具有抗朊病毒和抗肿瘤的活性。Radotinib 能够抑制肿瘤细胞增殖，诱导细胞周期阻滞和凋亡 (apoptosis)。Radotinib 可用于慢性髓细胞白血病、多发性骨髓瘤等肿瘤和朊病毒病等神经退行性疾病的研究。				
IC50 & Target[1]	JAK2	STAT3			
In Vitro	Radotinib (0-100 μM; 72 h) 能抑制多种多发性骨髓瘤细胞系的增殖，诱导细胞凋亡和细胞周期阻滞。机制涉及对 STAT3 和 JAK2 信号通路的抑制[1]。				
	Radotinib (0-40 μM; 24 h) 在感染 22L 或 139A 瘙痒病株的 ZW13-2 神经元细胞中降低了 PrPSc 水平[2]。				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:	RPMI-8226, MM.1S, U266B1, and IM-9 cells			
	Concentration:	0, 10, 50 and 100μM			
	Incubation Time:	72 h			
In Vivo	Result:	Inhibited the cell viability in a dose-dependent manner.			
	Radotinib (100 mg/kg; 腹腔注射; 每天一次, 除周末外; 21 天) 在植入 IM-9 细胞的裸鼠模型中具有抗肿瘤的活性[1]。				
	Radotinib (100 mg/kg; 灌胃; 4-8 周) 在感染 263K 瘙痒病株的仓鼠中，可延长仓鼠的存活时间减少的 PrPSc 沉积[2]				
	Animal Model:	Athymic nude male mice aged five weeks old treated IM-9 cells[1]			
	Dosage:	100 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; once a day except on weekends; 21 days			
	Result:	Inhibited the growth of xenografted IM-9 cells in nude mice.			
	Repressed the expression of the activity and expression of STAT3, and its downstream proteins including Bcl-xL, Mcl-1, c-Myc, cyclin D1, and cyclin D3 in IM-9 cells isolated from the tumor tissue.				
	Dramatically reduced the expression of phospho-STAT3-positive cells in the tumor tissue. Significantly increased the number of TUNEL-positive cells in the tumor tissue.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 5 mg/mL (9.43 mM); 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8850 mL	9.4251 mL	18.8501 mL
		5 mM	0.3770 mL	1.8850 mL	3.7700 mL
10 mM		---	---	---	
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。					



	储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。 动物实验： 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.94 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 5.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
参考文献	[1]. Heo SK, et al. Radotinib inhibits multiple myeloma cell proliferation via suppression of STAT3 signaling. PLoS One. 2022 May 3;17(5):e0265958. [2]. Choi YG, et al. Radotinib Decreases Prion Propagation and Prolongs Survival Times in Models of Prion Disease. Int J Mol Sci. 2023 Jul 31;24(15):12241. [3]. Kim SH, et al. Efficacy and safety of radotinib in chronic phase chronic myeloid leukemia patients with resistance or intolerance to BCR-ABL1 tyrosine kinase inhibitors. Haematologica. 2014 Jul;99(7):1191-6.				
完整储备液配制表： 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80° C, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8850 mL	9.4251 mL	18.8501 mL	47.1254 mL
	5 mM	0.3770 mL	1.8850 mL	3.7700 mL	9.4251 mL