

Catalog Number: CM04169

产品信息

Catalog Number:
CM04169

CAS号:
1254053-43-4

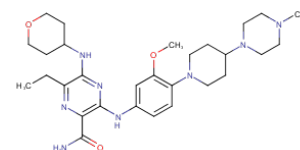
分子式:
C₂₉H₄₄N₈O₃

主要靶点:
FLT3c-Kit|TAM Receptor

主要通路:
蛋白酪氨酸激酶|血管生成|蛋白酪氨酸激酶|蛋白酪氨酸激酶

分子量:
552.71

溶解度:
DMSO:1 mg/mL (1.81 mM);
Ethanol:4 mg/mL (7.24 mM);
H₂O:Insoluble;



靶点活性

TYK1/LTK:0.35 nM|FLT3:0.29 nM|c-Kit:230 nM|Axl:0.73 nM|EML4-ALK:1.2 nM

体外活性

方法: 人急性髓细胞白血病细胞 MV4-11 和 MOLM-13 用 Gilteritinib (0.01-100 nM) 处理 5 天, 使用 CellTiter-Glo 检测细胞增殖。 **结果:** Gilteritinib 抑制 MV4-11 和 MOLM-13 细胞的生长, 平均 IC₅₀ 值分别为 0.92 nM 和 2.9 nM。 [1] **方法:** 人急性髓细胞白血病细胞 Molm14 用 Gilteritinib (5-20 nM) 处理 1-24 h, 使用 Western Blot 检测靶点蛋白表达水平。 **结果:** 当与 Molm14 细胞孵育 1 h 时, Gilteritinib 有效地抑制了 FLT3 及其下游信号通路的活性。 但是到 24 h, 尽管 FLT3 持续受到抑制, 但 ERK 信号传导反弹, 如 pERK 上调。 [2]

体内活性

方法: 为测试体内抗肿瘤活性, 将 Gilteritinib (1-10 mg/kg) 口服给药给携带人急性髓细胞白血病肿瘤 MV4-11 的 Nude 小鼠, 每天一次, 持续二十八天。 **结果:** 在 1 mg/kg/天 (63%) 和 3 mg/kg/天 (80%) 剂量下观察到 MV4-11 肿瘤的显著生长抑制。 并且在 6 mg/kg/天 (93%) 和 10 mg/kg/天 (100%) 剂量下观察到肿瘤几乎完全消退。 [1]

动物实验

Mice Antitumor activity is evaluated in nude mice transplanted with MV4-11 AML cells. The pharmacokinetics in xenografted mice is also investigated. MV4-11 xenografted-mice are treated with oral administration of Gilteritinib at 10 mg/kg for 4 days. Treatment of Gilteritinib for 28 days results in dose-dependent inhibition of MV4-11 tumor growth and induces complete tumor regression at more than 6 mg/kg

细胞实验

Gilteritinib is dissolved in DMSO and stored, and then diluted with appropriate media before use. The effect of Gilteritinib on MV4-11 and MOLM-13 cells is assessed using the CellTiter-Glo Luminescent Cell Viability Assay. Subsequent studies are conducted to examine the effect of Gilteritinib and Quizartinib on Ba/F3 cells expressing either FLT3-ITD, FLT3-D835Y, FLT3-ITD-D835Y, FLT3-ITD-F691L, or FLT3-ITD-F691I. MV4-11 and MOLM-13 cells are treated with DMSO or increasing concentrations of Gilteritinib (0.01, 0.1, 1, 10, and 100 nM) for 5 days, and cell viability is measured using CellTiter-Glo

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.