

Roscovitine; Seliciclib; CYC202

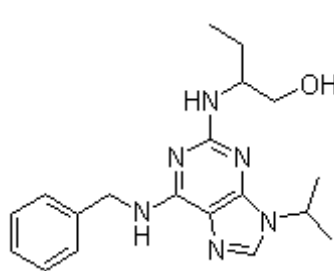
产品编号: MB4039

质量标准: >98%, 选择性 CDK 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C19H26N6O	结 构 式	
分子量	354.45		
CAS No.	186692-46-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 71 mg/mL (200.31 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 6 mg/mL (16.92 mM)		
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: Roscovitine 是有效, 选择性的 CDKs 抑制剂。

别名: CYC202; R-roscovitine; Seliciclib; 1-Butanol,

2-[[[9-(1-methylethyl)-6-[(phenylmethyl)amino]-9H-purin-2-yl]amino]-, (2R)-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 71 mg/mL (200.31 mM); Water Insoluble; Ethanol: 6 mg/mL (16.92 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Roscovitine (Seliciclib,CYC202)是一种有效的,选择性 CDK 抑制剂,作用于 Cdc2, CDK2 和 CDK5 时, 无细胞试验中 IC50 分别为 0.65 μM, 0.7 μM 和 0.16 μM, 对 CDK4/6 几乎没有作用。				
靶点	CDK5/p35 (Cell-free assay)	Cdc2/CyclinB (Cell-free assay)	CDK2/CyclinA (Cell-free assay)	CDK2/CyclinE (Cell-free assay)	ERK2 (Cell-free assay)
	0.16 μM	0.65 μM	0.7 μM	0.7 μM	14 μM
体外研究	Roscovitine 作用于细胞周期蛋白依赖性激酶具有高效性和高度选择性, 作用于 cdc2/cyclin B, cdk2/cyclin A, cdk2/cyclin E 和 cdk5/p53 时 IC50 分别为 0.65,0.7,0.7 和 0.16 μM。纳摩尔级 Roscovitine 作用于海星卵母细胞和海胆胚胎, 可逆抑制在前中期间转变, 在体外作用于非洲爪蟾卵提取物, 抑制 M 期促进因子活性和体外 DNA 合成,且抑制哺乳动物细胞系增殖, IC50 为 16				

	<p>μM。浓度为 7.5, 12.5 和 25 mM 的 Roscovitine 作用于肾小球系膜细胞,导致 CDK2 活性分别降低 25,50% 和 100%, 这种作用存在剂量依赖性。最新研究显示 Roscovitine 作用于盘基网柄菌,抑制 cdk5 激酶活性,细胞增殖,多细胞发展,和 cdk5 核转运, 不会影响 cdk5 蛋白表达。</p>
体内研究	<p>Roscovitine 按 50 mg/kg 剂量作用于 Ewing's 肉瘤家族(ESFT)移植瘤, 明显抑制肿瘤生长。 [4] Roscovitine 作用于携带 MCF7 移植瘤的裸鼠, 增强抗癌 Doxorubicin 抗癌效果,不会提高毒性, 机制是使细胞周期停滞而不是引起凋亡。</p>

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)

MB4022	SNS-032 (BMS-387032)
MB4353	THZ1
MB4229	夫拉平度(Alvocidib)

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。Roscovitine (Seliciclib,CYC202)是一种有效的, 选择性 CDK 抑制剂, 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		2.8213 mL	14.1064 mL	28.2127 mL
5 mM		0.5643 mL	2.8213 mL	5.6425 mL
10 mM		0.2821 mL	1.4106 mL	2.8213 mL
50 mM		0.0564 mL	0.2821 mL	0.5643 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>酶实验: 激酶活性实验在 30°C 下 buffer C 中进行。从数据中除去空白值, 在 10 分钟的温育期中测定渗透到蛋白受体中的磷酸摩尔数, 来计算活性。对照组用适当稀释的 DMSO 处理。在一些情况下, SDS/PAGE 后通过自动射线照相术测定底物磷酸化。p34cdc2/cyclin B 通过亲和色谱从 M 期海星卵母细胞中纯化。使用 1 mg 组蛋白 H1/mL,在 15 μM [γ-32P]ATP 存在时进行实验, 终浓度为 30 μL。在 30°C 下温育 10 分钟, 25-μL 上清液 转移到 Whatman P81 磷酸纤维素纸上, 20 秒后, 用 10mL 磷酸/L 水冲洗过滤器 5 次, 每次至少 5 分钟。湿式过滤器转移到 6 mL 闪烁管,加入 5 mL ACS 闪烁液, 使用 Packard 计数器测定放射性。测定在 10 分钟温育期中组蛋白 H1 渗透放入磷酸摩尔数评估激酶活性或者最大活性百分数。感染不同杆状病毒的 sf9 昆虫细胞抽提物中再生 p33cdk2/cyclin A 和 p33cdk2/cyclinE。Cyclins A 和 E 是谷胱甘肽 S-转移酶融合蛋白, 复合体从谷胱甘肽-琼脂糖珠上纯化。使用 1 mg/mL 组蛋白 H1/mL,在 15 μM [γ-32P]ATP 存在时, 进行激酶活性实验 10 分钟, 终体积为 30 μL, 测定 p34cdc2/cyclin B 激酶。p33cdk5/p35 从牛脑中纯化,除了 Mono S-色层分离一步法。Superose 12 柱的活性片段汇集,终浓度为 25 μg 酶/mL。使用 1 mg/mL 组蛋白 H1, 在 15 μM [γ-32P]ATP 存在时, 进行激酶活性实验 10 分钟, 终体积为 30 μL, 测定 p34cdc2/cyclin B 激酶。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 白血病, 非小细胞肺癌,结肠癌, 中枢神经系统肿瘤, 恶性黑色素瘤,卵巢癌, 肾癌, 前列腺</p>

	<p>腺癌, 胸腺癌细胞系</p> <p>Concentrations: 0.01 到 100 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 包括 9 种肿瘤类型的 60 种人类肿瘤细胞系培养 24 小时, 然后用 0.01-100 μM Roscovitine 持续处理 48 小时。进行 sulforhodamine B 蛋白实验测评毒性。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 右后侧皮下注射 A4573 细胞的 CD1 nu/nu 鼠</p> <p>Formulation: Roscovitine 溶于无水甲醇或 DMSO, 然后用 10% Tween-80, 20% N-N-二甲基乙酰胺, 和 70% PEG 400 稀释</p> <p>Dosages: \leq50 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</p>

【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(M ²)	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。