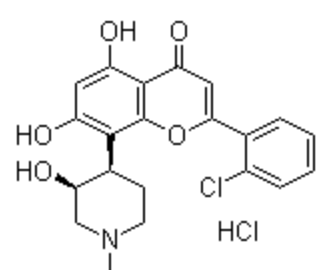


## Flavopiridol HCl; Alvocidib HCl; 夫拉平度盐酸盐

产品编号: MB4040  
质量标准: >98%,BR  
包装规格: 10MG;25MG;50MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>20</sub> ClNO <sub>5</sub> ·HCl	结 构 式	
分子量	438.3		
CAS No.	131740-09-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 88 mg/mL (200.77 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:** Flavopiridol Hydrochloride 是一种 CDK 的广谱抑制剂, 与 ATP 竞争性地抑制 CDK1, CDK2 和 CDK4 等的活性。

**别名:** 夫拉平度盐酸盐; HL 275; NSC 649890; MDL 107826A; FLAVOPIRIDOL HCL; Alvocidib Hydrochloride; 4H-1-Benzopyran-4-one, 2-(2-chlorophenyl)-5,7-dihydroxy-8-[(3S,4R)-3-hydroxy-1-methyl-4-piperidinyl]-, hydrochloride (1:1)

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至卡其色固体

溶解性: .....DMSO: 88 mg/mL (200.77 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>	Flavopiridol HCl 与 ATP 竞争性抑制 CDKs, 作用于 CDK1, CDK2, CDK4 和 CDK6, 无细胞试验中 IC <sub>50</sub> 为~40 nM。作用于 CDK1/2/4/6 比作用于 CDK7 选择性高 7.5 倍。Flavopiridol 最初被发现可抑制 EGFR 和 PKA。				
<b>靶点</b>	CDK1 (Cell-free assay)	CDK2 (Cell-free assay)	CDK4 (Cell-free assay)	CDK6 (Cell-free assay)	CDK7 (Cell-free assay)
	40 nM	40 nM	40 nM	40 nM	300 nM

<b>体外研究</b>	Flavopiridol 最初被发现抑制表皮生长因子受体和蛋白激酶 A 的活性, IC50 分别是 21 μM and 122 μM。Flavopiridol 是后来证明能够抑制细胞的增殖, 在多种生理相关浓度(IC50 = 66 nM), 在肿瘤细胞系美国国家癌症研究所开发治疗计划中的 60 种人癌细胞系测试过。Flavopiridol 以时间和浓度依赖性方式诱导人类乳腺癌细胞 G1 期阻滞并抑制 CDK2 和 CDK4。Flavopiridol 短时处理 (约 12 小时) 诱导造血细胞系的细胞凋亡, 包括 SUDHL4, SUDHL6 (B 细胞系), Jurkat 和 MOLT4 (T 细胞系) 和 HL60 (髓细胞系)。在克隆形成实验中, Flavopiridol 在 23 人肿瘤模型中表现高细胞毒性, 平均 IC70 是 8 ng/mL。最近的一项研究表明 Flavopiridol 诱导人脑胶质瘤 T98G 细胞系的 AKT-Ser473 磷酸化。
<b>体内研究</b>	以最大耐受剂量 10 mg/kg/day 在第 1-4 天及 7-11 天给药, Flavopiridol 表现为 PRXF1337 肿瘤消退和 PRXF1369 肿瘤停滞为期 4 周。用 7.5 mg/kg Flavopiridol 静脉内 (IV) 或腹膜内连续注射 5 天后, 12 分之 11 的皮下 (SC) 人 HL-60 移植鼠的肿瘤完全消退, Flavopiridol 治疗一疗程后移植鼠数月无病。在 SUDHL-4 皮下注射淋巴瘤模型鼠中静脉注射 Flavopiridol (7.5 mg/kg), 模型鼠的肿瘤大部分 (8 分之 2) 或者完全 (8 分之 4) 消退, 两只剩余动物无病超过 60 天。整体生长延迟 73.2%。

**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。Flavopiridol Hydrochloride 是一种 CDK 的广谱抑制剂, 与 ATP 竞争性地抑制 CDK1, CDK2 和 CDK4 等的活性。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2815 mL	11.4077 mL	22.8154 mL
5 mM	0.4563 mL	2.2815 mL	4.5631 mL
10 mM	0.2282 mL	1.1408 mL	2.2815 mL
50 mM	0.0456 mL	0.2282 mL	0.4563 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>重组 CDKs 激酶反应:</b></p> <p>CDKs 的活性按如下方式在酶标板中, 40 μg GST-R b 与不同量 Flavopiridol 和未标记的 ATP 混合。反应然后通过加入 S100 的馏分从表达重组人 CDK 的昆虫细胞中得到的硫酸铵沉淀部分的开始。最终反应条件为 10 mM MgCl<sub>2</sub>, 50 mM Tris-HCl (pH 7.5)和 1 mM DTT。ATP 的终浓度做相应的调整。放射性标记的 ATP 作为磷酸供体。该反应在 30°C下加入酶后进行 2.5 分钟, 然后加入 EDTA 终止。GST-Rb 用谷胱甘肽 - 琼脂糖标记和掺入的放射性通过液体闪烁计数测定。</p>
-------------	---

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> SUDHL4, SUDHL6, Jurkat, MOLT4 和 HL60 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 0, 100 500, 5000 nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 14 小时</p> <p><b>Method:</b> 在密度为 <math>1 \times 10^6</math> cells/mL 的细胞中不同时间加入不同浓度的 Flavopiridol。提取 DNA。细胞用冷的磷酸盐缓冲盐水 (PBS) 洗涤一次并在 4°C 条件下在 3 mL 裂解缓冲液 (5 mM Tris-HCL [pH 7.5]; 20 mM EDTA; 0.5% Triton X-100) 中裂解 15 分钟。将细胞裂解物的染色质 (以 26,000 g, 4°C, 20 分钟) 离心分离。用苯酚, 酚氯仿 (1:1) 和氯仿从上清液提取提取小的 DNA 片段。核酸在 -20°C 中在 0.5M 氯化钠, 90% 的乙醇沉淀过夜。RNA 由牛 RNAaseA 消化 (60µg/mL)。连续反萃取和沉淀后, DNA 溶解在 10mM Tris-HCl (pH 值 7.5), 1mM 的 EDTA, 0.5% 十二烷基硫酸钠 (SDS), 而后在 1.6% 琼脂糖凝胶上电泳。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 人类前列腺癌异种移植, PRXFI337 和 PRXFI369, 皮下种植在裸鼠中</p> <p><b>Formulation:</b> 溶解在水中</p> <p><b>Dosages:</b> 10 mg/kg/d</p> <p><b>Administration:</b> 在 days 1-4 and 7-11 口服。</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。