

Ribociclib ; LEE011

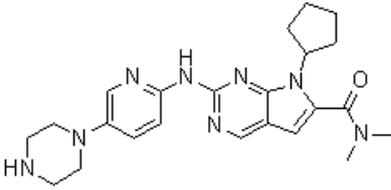
产品编号 : MB5136

质量标准 : ≥98%,高度特异性 CDK4/6 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H30N8O	结 构 式	
分子量	434.54		
CAS No.	1211441-98-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 7 mg/mL (16.1 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 : LEE011 是高选择性的 CDK4/6 抑制剂。

别名 : 瑞博西尼 ; LEE011 ; 7H-Pyrrolo[2,3-d]pyrimidine-6-carboxamide, 7-cyclopentyl-N,N-dimethyl-2-[[5-(1-piperazinyl)-2- pyridinyl]amino]-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至卡其色固体

溶解性 :DMSO 7 mg/mL (16.1 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

产品描述	Ribociclib (LEE011)是一种口服具有活性的, 高度特异性 CDK4/6 抑制剂。	
特性	口服生物有效的 CDK4/6 选择性抑制剂, 处于III期临床测试, 用于晚期乳腺癌的治疗。	
靶点	CDK4 (Cell-free assay)	CDK6 (Cell-free assay)

体外研究	LEE011 是一种 CDK4/CDK6 的双重抑制剂，能够显著抑制 17 种神经细胞瘤中的 12 种的生长，平均 IC50 值是 307 nM。对神经细胞瘤的抑制主要是抑制细胞的生长，受到 G1 细胞周期阻滞和细胞衰老的调控。
体内研究	LEE011 (200 mg/kg 每日，口服)引起小鼠中的 BE2C 或者 1643 细胞显著的生长延迟，没有体重减轻或者其它的毒性症状。

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)

MB5374	Abemaciclib,LY2835219
MB4636	AMG925
MB5135	LY2835219 mesylate

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。LEE011 是高选择性的 CDK4/6 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3013 mL	11.5064 mL	23.0128 mL
5 mM	0.4603 mL	2.3013 mL	4.6026 mL
10 mM	0.2301 mL	1.1506 mL	2.3013 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: BE2C, IMR5, 1643, SY5Y, CHP134, SKNSH, NGP, KELLY, LAN5, NLF, NB69, SKNDZ, NBSD, NBL5, SKNFI, EBC1, SKNAS, NB16, RPE1 细胞系。</p> <p>Concentrations: 10 μM</p> <p>Incubation Time: ~100 小时</p> <p>Method: 将板中优先附着基底生长的神经母细胞瘤细胞系以一式三份种植于 Xcelligence 实时细胞电子传感系统，用 4 个剂量梯度的抑制剂和 DMSO 为对照处理细胞 24 小时。连续监测细胞约 100 个小时，IC50 通过以下方法测得：通过绘制细胞指数为时间的函数产生生长曲线，以在治疗开始时细胞指数为 1 作为标准。从治疗开始到处理 96 小时后，生长曲线下的面积通过基线下面积为 1 (治疗开始时的细胞指数) 进行计算。积分面积以 DMSO 处理的对照组作为背景。抑制剂比上对照组的值取非线性对数值来计算。所有的实验至少重复一次。</p>
动物实验	<p>Animal Models: BE2C, NB-1643,或 EBC1 异种移植的小鼠。</p>

Formulation: 0.5%甲基纤维素
Dosages: ~200 毫克/千克 每天
Administration: 口服

【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。