

Abemaciclib ; LY2835219

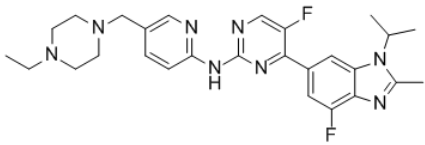
产品编号：MB5374

质量标准：>98%，CDK4 和 CDK6 选择性抑制剂

包装规格：5MG；25MG

产品形式：结晶性固体

基本信息

分子式	C27H32F2N8	结 构 式	
分子量	506.59		
CAS No.	1231929-97-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	溶于 DMSO		
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： Abemaciclib(LY2835219)对 CDK4 和 CDK6 的 IC₅₀ 分别为 2 nM 和 10 nM。

别名： Abemaciclib ; LY2835219

N-[5-[(4-ethyl-1-piperazinyl)methyl]-2-pyridinyl]-5-fluoro-4-[4-fluoro-2-methyl-1-(1-methylethyl)-1H-benzimidazol-6-yl]-2-pyrimidinamine, methanesulfonate

物理性状及指标：

外观：.....结晶性固体

λ_{max}：.....245, 272, 299 nm

溶解性：.....溶于 DMSO

纯度：.....>98%

储存条件： -20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	LY2835219 游离碱对 CDK4 和 CDK6 的 IC ₅₀ 分别为 2 nM 和 10 nM。				
靶点	Cdk4/cyclin D1	CDK6/cyclinD1	CDK9/cyclinT1	CDK5/p35	Cdk5/p25
	2 nM (IC ₅₀)	10 nM (IC ₅₀)	57 nM (IC ₅₀)	287 nM (IC ₅₀)	355 nM (IC ₅₀)
	CDK2/cyclinE	CDK1/cyclinB1	CDK7/Mat1/cyclinH1	PIM1	PIM2
	504 nM (IC ₅₀)	1627 nM (IC ₅₀)	3910 nM (IC ₅₀)	50 nM (IC ₅₀)	3400 nM (IC ₅₀)
	HIPK2	DYRK2	CK2	GSK3b	JNK3
	31 nM (IC ₅₀)	61 nM (IC ₅₀)	117 nM (IC ₅₀)	192 nM (IC ₅₀)	389 nM (IC ₅₀)
FLT3 (D835Y)	DRAK1	FLT3			

	403 nM (IC ₅₀)	659 nM (IC ₅₀)	3960 nM (IC ₅₀)
体外研究	LY2835219 减少细胞生存能力的 IC ₅₀ 值从 0.5μM 到 0.7μM,抑制一种蛋白激酶和 ERK 信号而不是 mTOR 激活在头颈部鳞状细胞癌(HNSCC)细胞。LY2835219 显示抑制 A375R1-4,M14R,SH4R EC ₅₀ 值从 0.3 到 0.6μM;LY2835219 抑制亲代 A375 和耐药 A375RV1 和 A375RV2 细胞的增殖, 具有类似的能力, IC ₅₀ 的值分别为 395、260 和 463 nM。LY2835219 抑制低纳米级的 CDK4 和 CDK6, 抑制 Rb 磷酸化, 导致 G1 抑制和抑制增殖, 其活性对 Rb 细胞是特异性的		
体内研究	LY2835219 (45 mg/kg, p.o.)与 everolimus 结合, 在 HNSCC 异种移植瘤中产生协同抗肿瘤作用。LY2835219(45 或 90 mg/kg, p.o.)在 A375 异种移植瘤模型中显示明显的肿瘤生长抑制。		

美仑相关产品推荐

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。Abemaciclib 是 CDK4 和 CDK6 选择性抑制剂, 可以用于相关领域的科学研究。

储液配置

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9740 mL	9.8699 mL
5 mM	0.3948 mL	1.9740 mL	3.9480 mL	
10 mM	0.1974 mL	0.9870 mL	1.9740 mL	

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	细胞 (5×10 ³) 铺在 96 孔板中。第二天将细胞处理 24 至 48 小时, 然后按照制造商的说明书和发光平板读数器通过 Caspase-Glo-3/7 测定评估半胱天冬酶-3 活性。
细胞实验	LY28 35219 溶解在 DMSO 中, 浓度为 10 毫克。 细胞接种在 96 孔板中, 允许粘附过夜, 并用 DMSO 控制 (0.1% V/V) 或所指示的化合物处理 72 小时。根据生产商的说明书, 使用细胞计数试剂盒测定细胞活力和增殖。Ly235219 和 mTOR 抑制剂之间的相互作用用 CypSyn 确定。组合指数 (CI) 值为 1 表示加性药物相互作用, 而 CI < 1 是协同作用, CI > 1 是拮抗作用。
动物实验	LY28 35219 在 20 毫米磷酸盐缓冲液中溶解在 1% HEC 中。 用 OSC-19 (1×10 ⁶) 细胞皮下注射六周龄 BALB/c 雌性裸鼠。当肿瘤大小达到约 100 平方毫米时, 小鼠按肿瘤大小随机化, 并进行各种治疗。每个治疗组至少包括 5 只小鼠。每组小鼠通过每日口服灌胃给药, LY28 35219 (45 mg/kg/d 或 90 mg/kg/d), 依维莫司 (5 mg/kg/d), 或两者的组合。LY28 35219 溶解在 1% HEC 中, 在 20 mM 磷酸盐缓冲液 (PH2.0) 中溶解。每周测量两次肿瘤大小和体重。肿瘤体积用以下公式计算: V = (L×W ²) / 2。小鼠在第 14 天灌胃最后一次, 第二天处死。取瘤组织进行 Western blot 和免疫组织化学染色。

【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。