



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: Riviciclib hydrochloride

CAS 号: 920113-03-7

产品货号: S88791

生物活性:

生物活性:				
Description	Rivicielib hydrochloride (P276-00) 是有效的 CDK 抑制剂, 抑制 CDK9-cyclinT1, CDK4-cyclin D1, CDK1-cyclinB 的 IC50 值分别为 20 nM, 63 nM, 79 nM。Rivicielib hydrochloride (P276-00) 对 Cisplatin 耐药性细胞具有抗肿瘤活性。			
IC50 & Target[1]	CDK9- Cyclin T1 0.020μM (IC50) cdk2-cyclin E 2.500μM (IC50)	cdk4-cyclin D1 0.063μM (IC50) cdk6-cyclin D3 0.396μM (IC50)	CDK1-Cyclin B 0.079μM (IC50) CDK9-cyclin H 2.900μM (IC50)	cdk2-cyclin A 0.224μM (IC50)
In Vitro	Rivicielib hydrochloride (1.5-5 μM; 72 小时) 在早幼粒细胞白血病细胞的 G1 期和 G2 期末检测到细胞, 在同步的人非小细胞肺癌 (H-460) 和人正常肺成纤维细胞 (WI) 中 G1 期细胞停滞-38) 细胞[3]。			
	Rivicielib hydrochloride (3-24 小时; 1.5 μM) 降低 H-460 细胞中的细胞周期蛋白 D1、Cdk4 和 Rb 水平。Ser780 处的 Rb (视网膜母细胞瘤) 磷酸化在 3 h 时降低[2]。			
	Rivicielib hydrochloride 在结肠癌、骨肉瘤、宫颈癌和膀胱癌细胞等人类癌细胞系中表现出活性[2]. Cell Cycle Analysis[3]			
	Cell Line:	Promyelocytic leukemia cells (HL-60 cells), non-small cell carcinoma (H-460) cells, human normal lung fibroblast (WI-38) cells		
	Concentration:	1.5, 5μM		
	Incubation Time:	72 hours		
	Result:	Showed apoptosis at the end of 24 h and no detectable cells were present in G1 and G2 in HL-60 cells. Caused an exclusive G1 arrest of synchronous population of cancerous cells H-460 cells and normal cells WI-38.		
	Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:	H-460 cells; MCF-7 cells		
	Concentration:	1.5μM		
Incubation Time:	3, 6, 9, 12, 24 hours			
Result:	Reduced cyclin D1, Cdk4, and Rb levels in H-460 cells. Rb (retinoblastoma) phosphorylation at Ser ⁷⁸⁰ decrease at 3 h. Decreased protein levels of cyclin D1 and Cdk4 levels staring at 6 and 9 h in MCF-7 cells, respectively, and accompanied by a decrease in phosphorylation of Rb at Ser ⁷⁸⁰ from 6 h onward, followed by reduced Rb levels at 24 h.			
In Vivo	Rivicielib hydrochloride (腹腔给药; 每天 35 kg/mg, 持续 10 天, 在严重联合免疫缺陷小鼠的人异种移植模型中) 对人结肠癌 HCT-116 异种移植物的生长有显著抑制作用[3]。			
	Rivicielib hydrochloride (通过腹腔注射; 给药; 50 mg/kg 每天一次; 30 mg/kg 每天两次, 共 18 次处理, 在严重联合免疫缺陷小鼠的人异种移植模型中) 显著抑制生长[3]			
	Animal Model:	Human xenograft mode with HCT-116 tumor model (severe combined immunodeficient mice)[3]		



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	Dosage:	35 mg/kg			
	Administration:	Administered i.p.; daily for 10 days			
	Result:	Given 35 mg/kg showed significant inhibition in the growth.			
	Animal Model:	Human xenograft model with H-460 tumor xenograft (severe combined immunodeficient mice)[3]			
	Dosage:	50 mg/kg; 30 mg/kg			
	Administration:	Administered i.p.; 50 mg/kg once daily for 20 days; Administered i.p.; 30 mg/kg twice daily for 18 treatments			
	Result:	Given 50 mg/kg and 30 mg/kg twice daily significantly inhibited growth.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (114.08 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	H2O 中的溶解度 : 25 mg/mL (57.04 mM; 超声助溶)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	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
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.75 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.75 mM); 澄清溶液				



	此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.75 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Roskoski R Jr,Cyclin-dependent protein kinase inhibitors including palbociclib as anticancer drugs.Pharmacol Res. 2016 May;107:249-275. [2]. Joshi KS, et al. In vitro antitumor properties of a novel cyclin-dependent kinase inhibitor, P276-00. Mol Cancer Ther. 2007 Mar;6(3):918-25. [3]. Joshi KS,et al. P276-00, a novel cyclin-dependent inhibitor induces G1-G2 arrest, shows antitumor activity on cisplatin-resistant cells and significant in vivo efficacy in tumor models. Mol Cancer Ther. 2007 Mar;6(3):926-34.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.2815 mL	11.4077 mL	22.8154 mL	57.0386 mL
	5 mM	0.4563 mL	2.2815 mL	4.5631 mL	11.4077 mL
	10 mM	0.2282 mL	1.1408 mL	2.2815 mL	5.7039 mL
	15 mM	0.1521 mL	0.7605 mL	1.5210 mL	3.8026 mL
	20 mM	0.1141 mL	0.5704 mL	1.1408 mL	2.8519 mL
	25 mM	0.0913 mL	0.4563 mL	0.9126 mL	2.2815 mL
	30 mM	0.0761 mL	0.3803 mL	0.7605 mL	1.9013 mL
	40 mM	0.0570 mL	0.2852 mL	0.5704 mL	1.4260 mL
	50 mM	0.0456 mL	0.2282 mL	0.4563 mL	1.1408 mL
DMSO	60 mM	0.0380 mL	0.1901 mL	0.3803 mL	0.9506 mL
	80 mM	0.0285 mL	0.1426 mL	0.2852 mL	0.7130 mL
	100 mM	0.0228 mL	0.1141 mL	0.2282 mL	0.5704 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。