



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: Enitociclib; (+)-BAY-1251152; (+)-VIP152; (S)-Enitociclib
CAS 号: 1610358-56-9
产品货号: S89005

生物活性:

Description	(+) -Enitociclib ((+) -BAY-1251152) 是 Enitociclib (HY-103019E) 的对映体, 旋光性为 (+)。Enitociclib 是一种选择性 CDK9 抑制剂和凋亡 (apoptosis) 诱导剂。Enitociclib 通过抑制 CDK9 活性, 减少 RNA 聚合酶 Pol II 羧基末端结构域 (CTD) 丝氨酸 2 (Ser2) 的磷酸化, 从而下调 MYC、MCL1 等关键致癌基因的转录。Enitociclib 具有靶向 MYC+ 淋巴瘤和多发性骨髓瘤 (MM) 细胞的抗增殖活性, 与 Bortezomib (HY-10227)、Lenalidomide 具有协同作用, 可用于血液系统恶性肿瘤研究。				
IC50 & Target[1]	CDK9/CycT1 3 nM (IC50)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	A2780	IC50	52 nM	Antiproliferative activity against human A2780 cells assessed as inhibition of cell growth in presence of fetal calf serum incubated for 96 hrs measured by celltiter-glo luminescent cell viability assay	
	MOLM-13	IC50	29 nM	Antiproliferative activity against human MOLM-13 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 72 hrs by MTT assay	
	MOLM-13	IC50	42 nM	Antiproliferative activity against human MOLM-13 cells assessed as inhibition of cell growth in presence of fetal calf serum incubated for 96 hrs measured by celltiter-glo luminescent cell viability assay	
In Vivo	Animal Model:		Female SCID mice with OCI-LY-3 cells[2]		
	Dosage:		10 mg/kg		
	Administration:		Intravenous injection; once every seven days; for 14 days		
	Result:		Inhibited tumour growth and had good tolerability.		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 113.3 mg/mL (280.15 mM); 超声加热助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.4726 mL	12.3631 mL	24.7262 mL
		5 mM	0.4945 mL	2.4726 mL	4.9452 mL
		10 mM	0.2473 mL	1.2363 mL	2.4726 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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					



	请您现用现配, 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.18 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.18 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.18 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Frigault MM, et al. Enitociclib, a Selective CDK9 Inhibitor, Induces Complete Regression of MYC+ Lymphoma by Downregulation of RNA Polymerase II Mediated Transcription. Cancer Res Commun. 2023 Nov 9;3(11):2268-2279. [Content Brief] [2]. Tran S, et al. Enitociclib, a selective CDK9 inhibitor: in vitro and in vivo preclinical studies in multiple myeloma[J]. Blood Neoplasia, 2025, 2(1): 100050.

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° C, 2 years; -20° C, 1 year. -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4726 mL	12.3631 mL	24.7262 mL	61.8154 mL
	5 mM	0.4945 mL	2.4726 mL	4.9452 mL	12.3631 mL
	10 mM	0.2473 mL	1.2363 mL	2.4726 mL	6.1815 mL



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

	15 mM	0.1648 mL	0.8242 mL	1.6484 mL	4.1210 mL
	20 mM	0.1236 mL	0.6182 mL	1.2363 mL	3.0908 mL
	25 mM	0.0989 mL	0.4945 mL	0.9890 mL	2.4726 mL
	30 mM	0.0824 mL	0.4121 mL	0.8242 mL	2.0605 mL
	40 mM	0.0618 mL	0.3091 mL	0.6182 mL	1.5454 mL
	50 mM	0.0495 mL	0.2473 mL	0.4945 mL	1.2363 mL
	60 mM	0.0412 mL	0.2061 mL	0.4121 mL	1.0303 mL
	80 mM	0.0309 mL	0.1545 mL	0.3091 mL	0.7727 mL
	100 mM	0.0247 mL	0.1236 mL	0.2473 mL	0.6182 mL



源叶