



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: shyysw@sina.com

产品名称: **Dalpiciclib**
CAS 号: **1637781-04-4**
产品货号: **S89348**

生物活性:		
Description	Dalpiciclib (SHR-6390) 是一种具有口服活性和高选择性的 CDK4/6 抑制剂, IC50 值分别为 12.4 nM 和 9.9 nM。Dalpiciclib 对乳腺癌和食道鳞状细胞癌显示出抗肿瘤活性。	
IC50 & Target[1]	CDK4 12.4 nM (IC50)	CDK6 9.9 nM (IC50)
In Vitro	Dalpiciclib (0-4 μ M, 72 h) inhibits cell proliferation in a dose-dependent manner[3].	
	Dalpiciclib (0-10 μ M, 6 d) inhibits the proliferation of retinoblastoma-positive tumor cell lines[4].	
	Cell Proliferation Assay[3]	
	Cell Line:	Eca 109, Eca 9706, and KYSE-510 ESCC cell lines
	Concentration:	0-4 μM
	Incubation Time:	72 hours
	Result:	Inhibited cell proliferation in a dose-dependent manner, with Eca 109 being the relative sensitive one and Eca 9706 being the relative resistant one.
	Cell Viability Assay[4]	
	Cell Line:	MCF7, MCF7/TR, BT-474/T cell lines
	Concentration:	0-10 μM
Incubation Time:	6 days	
Result:	Inhibited MCF7/TR cells, parental MCF7 cells and BT-474/T resistant cells with the IC50 values of 229.5, 115.4 and 210.7 nM, respectively.	
In Vivo	Dalpiciclib (oral gavage; 150 mg/kg; once weekly; 3 weeks) shows antitumor activity against ESCC xenografts[3].	
	Dalpiciclib combined with Paclitaxel (PTX) or Cisplatin (CDDP) offer synergistic inhibitory effects in ESCC xenografts[3].	
	Dalpiciclib (oral gavage; 37.5 mg/kg, 75 mg/kg, 150 mg/kg; once daily; 30 days) shows antitumor activity in human xenograft models [4].	
	Animal Model:	NOD/SCID mice (ESCC PDXs models)[3]
	Dosage:	150 mg/kg
	Administration:	Oral gavage; 150 mg/kg; once weekly; 3 weeks
	Result:	Suppressed the growth of tumor.
	Animal Model:	5-week-old female Balb/cA-nude mice subcutaneously inoculated MCF7/ARO, COLO 205 and U87MG[4]
	Dosage:	37.5 mg/kg, 75 mg/kg, 150 mg/kg
	Administration:	Oral gavage; 37.5 mg/kg, 75 mg/kg, 150 mg/kg; once daily; 30 days
Result:	Caused regression of all tumor xenografts at the highest dose tested.	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (111.97 mM; ultrasonic and warming and adjust pH to 7 with 1 M HCL	



and heat to 60°C; 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	1 mg	5 mg
	Concentration			10 mg
	1 mM	2.2394 mL	11.1972 mL	22.3944 mL
	5 mM	0.4479 mL	2.2394 mL	4.4789 mL
	10 mM	0.2239 mL	1.1197 mL	2.2394 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。 -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。 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: 2.5 mg/mL (5.60 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 (5.60 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 (5.60 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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]. Jose Manuel Perez-Garcia, et al. Perez-Garcia JM, Cortes J, Llombart-Cussac A. CDK4/6 inhibitors in breast cancer: spotting the difference. Nat Med. 2021 Nov;27(11):1868-1869. [2]. Pin Zhang, et al. A phase 1 study of dalpiciclib, a cyclin-dependent kinase 4/6 inhibitor in Chinese patients with advanced breast cancer. Biomark Res. 2021 Apr 12;9(1):24. [3]. Jiayuan Wang, et al. CDK4/6 inhibitor-SHR6390 exerts potent antitumor activity in esophageal			



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

	squamous cell carcinoma by inhibiting phosphorylated Rb and inducing G1 cell cycle arrest. J Transl Med. 2017 Jun 2;15(1):127. [4]. Fei Long, et al. Preclinical characterization of SHR6390, a novel CDK 4/6 inhibitor, in vitro and in human tumor xenograft models. Cancer Sci. 2019 Apr;110(4):1420-1430.
--	---

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, 6 months; -20° C, 1 month。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2394 mL	11.1972 mL	22.3944 mL	55.9860 mL
	5 mM	0.4479 mL	2.2394 mL	4.4789 mL	11.1972 mL
	10 mM	0.2239 mL	1.1197 mL	2.2394 mL	5.5986 mL
	15 mM	0.1493 mL	0.7465 mL	1.4930 mL	3.7324 mL
	20 mM	0.1120 mL	0.5599 mL	1.1197 mL	2.7993 mL
	25 mM	0.0896 mL	0.4479 mL	0.8958 mL	2.2394 mL
	30 mM	0.0746 mL	0.3732 mL	0.7465 mL	1.8662 mL
	40 mM	0.0560 mL	0.2799 mL	0.5599 mL	1.3997 mL
	50 mM	0.0448 mL	0.2239 mL	0.4479 mL	1.1197 mL
	60 mM	0.0373 mL	0.1866 mL	0.3732 mL	0.9331 mL
	80 mM	0.0280 mL	0.1400 mL	0.2799 mL	0.6998 mL
	100 mM	0.0224 mL	0.1120 mL	0.2239 mL	0.5599 mL