



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: (R)-CR8 trihydrochloride

CAS 号: 1786438-30-9

产品货号: S89771

生物活性:				
Description	(R)-CR8 (CR8) trihydrochloride, a second-generation analog of Roscovitine, is a potent CDK1/2/5/7/9 inhibitor. (R)-CR8 trihydrochloride inhibits CDK1/cyclin B (IC50=0.09 μ M), CDK2/cyclin A (0.072 μ M), CDK2/cyclin E (0.041 μ M), CDK5/p25 (0.11 μ M), CDK7/cyclin H (1.1 μ M), CDK9/cyclin T (0.18 μ M) and CK1 δ/ϵ (0.4 μ M). (R)-CR8 trihydrochloride induces apoptosis and has neuroprotective effect[1][2]. (R)-CR8 trihydrochloride acts as a molecular glue degrader that depletes cyclin K[3].			
IC50 & Target	CDK1/cyclinB1 0.09 μ M (IC50)	cdk2/cyclin A 0.072 μ M (IC50)	CDK2/cyclinE 0.041 μ M (IC50)	Cdk5/p25 0.11 μ M (IC50)
In Vitro	(R)- CR8 trihydrochloride (CR8) trihydrochloride (0.1-100 μ M; 48 小时) 是一种有效的凋亡细胞死亡诱导剂, 对 SH-SY5Y 细胞系的 IC50 为 0.49 μ M[1]。 (R)- CR8 trihydrochloride trihydrochloride (0.25-10 μ M) 剂量依赖性地诱导聚-(ADP-核糖) 聚合酶 (PARP) 裂解[1]。 (R)- CR8 trihydrochloride 三盐酸盐的 CDK 结合形式具有暴露于溶剂中的吡啶基部分, 可诱导 CDK12-细胞周期蛋白 K 和 Cul4 衔接蛋白 DDB1 之间形成复合物, 绕过对 a 的要求底物受体和呈递细胞周期蛋白 K 以进行泛素化和降解[1]。 Cell Line: SH-SY5Y cell line Concentration: 0.1, 1, 10, 100 μ M Incubation Time: 24 hours Result: Reduced cell survival in a dose-dependent manner.			
In Vivo	(R)- CR8 trihydrochloride 三盐酸盐 (5 mg/kg; 腹腔注射) 在组织学评估中导致第 28 天的损伤大小显著减小[2]。 Animal Model: Adult (10 to 12 weeks old) male Sprague-Dawley rats (310 to 330 g)[2] Dosage: 5 mg/Kg Administration: i.p. Result: Resulted in a significant reduction in lesion size.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (92.44 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)			
Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.8487 mL	9.2435 mL	18.4870 mL
	5 mM	0.3697 mL	1.8487 mL	3.6974 mL
	10 mM	0.1849 mL	0.9244 mL	1.8487 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。				



	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: ≥ 2.17 mg/mL (4.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.01 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 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 21.7 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]. Bettayeb K, et al. CR8, a potent and selective, roscovitine-derived inhibitor of cyclin-dependent kinases. <i>Oncogene</i>. 2008 Oct 2;27(44):5797-807. [2]. Kabadi SV, et al. CR8, a novel inhibitor of CDK, limits microglial activation, astrocytosis, neuronal loss, and neurologic dysfunction after experimental traumatic brain injury. <i>J Cereb Blood Flow Metab</i>. 2014 Mar;34(3):502-13. [3]. Slabicki M, et al. The CDK inhibitor CR8 acts as a molecular glue degrader that depletes cyclin K [published online ahead of print, 2020 Jun 3]. <i>Nature</i>. 2020;10.1038/s41586-020-2374-x.
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 (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。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8487 mL	9.2435 mL	18.4870 mL	46.2176 mL
	5 mM	0.3697 mL	1.8487 mL	3.6974 mL	9.2435 mL
	10 mM	0.1849 mL	0.9244 mL	1.8487 mL	4.6218 mL
	15 mM	0.1232 mL	0.6162 mL	1.2325 mL	3.0812 mL
	20 mM	0.0924 mL	0.4622 mL	0.9244 mL	2.3109 mL
	25 mM	0.0739 mL	0.3697 mL	0.7395 mL	1.8487 mL
	30 mM	0.0616 mL	0.3081 mL	0.6162 mL	1.5406 mL
	40 mM	0.0462 mL	0.2311 mL	0.4622 mL	1.1554 mL
	50 mM	0.0370 mL	0.1849 mL	0.3697 mL	0.9244 mL
	60 mM	0.0308 mL	0.1541 mL	0.3081 mL	0.7703 mL
	80 mM	0.0231 mL	0.1155 mL	0.2311 mL	0.5777 mL

源叶