



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: **PF-06873600; Ebvaciclib**

CAS 号: **2185857-97-8**

产品货号: **S89991**

生物活性:

Description	PF-06873600 is a selective and orally bioavailable inhibitor of cyclin-dependent kinase (CDK), with Ki values of 0.09 nM, 0.13 nM and 0.16 nM for CDK2, CDK4 and CDK6, respectively. PF-06873600 has potential antineoplastic activity[1][2].				
IC50 & Target	CDK2 0.09 nM (Ki)	CDK4 0.13 nM (Ki)	CDK6 0.16 nM (Ki)		
In Vitro	PF-06873600 (Example 8) 是一种具有口服生物利用度的细胞周期蛋白依赖性激酶 (CDK) 抑制剂, 具有潜在的抗肿瘤活性[1]。PF-06873600 选择性靶向、结合并抑制 CDK 的活性。这些激酶的抑制导致细胞周期停滞、细胞凋亡的诱导和肿瘤细胞增殖的抑制。CDK 是 ATP 依赖性丝氨酸/苏氨酸激酶, 是细胞周期进程和细胞增殖的重要调节因子, 在肿瘤细胞中经常过度表达[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (176.73 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 / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1208 mL	10.6040 mL	21.2080 mL
		5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2416 mL
		10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.41 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 ddH ₂ O 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)				



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: shyyysw@sina.com

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.41 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 (4.41 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]. US 2018/0044344 A1. [2]. NCI Drug Dictionary

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	2.1208 mL	10.6040 mL	21.2080 mL	53.0200 mL
	5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2416 mL	10.6040 mL
	10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 mL	5.3020 mL
	15 mM	0.1414 mL	0.7069 mL	1.4139 mL	3.5347 mL
	20 mM	0.1060 mL	0.5302 mL	1.0604 mL	2.6510 mL
	25 mM	0.0848 mL	0.4242 mL	0.8483 mL	2.1208 mL
	30 mM	0.0707 mL	0.3535 mL	0.7069 mL	1.7673 mL
	40 mM	0.0530 mL	0.2651 mL	0.5302 mL	1.3255 mL
	50 mM	0.0424 mL	0.2121 mL	0.4242 mL	1.0604 mL
	60 mM	0.0353 mL	0.1767 mL	0.3535 mL	0.8837 mL
	80 mM	0.0265 mL	0.1326 mL	0.2651 mL	0.6628 mL
	100 mM	0.0212 mL	0.1060 mL	0.2121 mL	0.5302 mL