



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

产品名称: **Abemaciclib**

CAS 号: **1231929-97-7**

产品货号: **S92395**

生物活性:

生物活性:					
Description	Abemaciclib (LY2835219) is a selective and BBB-permeable CDK4/6 inhibitor with IC50 values of 2 nM and 10 nM for CDK4 and CDK6, respectively.				
IC50 & Target	Cdk4/cyclin D1	CDK6/cyclinD1	CDK9/cyclinT1	CDK5/p35	Cdk5/p25
	2 nM (IC50)	10 nM (IC50)	57 nM (IC50)	287 nM (IC50)	355 nM (IC50)
	CDK2/cyclinE	CDK1/cyclinB1	CDK7/Mat1/cyclinH1	PIM1	PIM2
	504 nM (IC50)	1627 nM (IC50)	3910 nM (IC50)	50 nM (IC50)	3400 nM (IC50)
	HIPK2	DYRK2	CK2	GSK3b	JNK3
	31 nM (IC50)	61 nM (IC50)	117 nM (IC50)	192 nM (IC50)	389 nM (IC50)
	FLT3 (D835Y)	DRAK1	FLT3		
	403 nM (IC50)	659 nM (IC50)	3960 nM (IC50)		
In Vitro	Abemaciclib 可降低细胞活力, IC50 值范围为 0.5 μM 至 0.7 μM, 可抑制头颈部鳞状细胞癌 (HNSCC) 细胞中的 Akt 和 ERK 信号传导, 但不抑制 mTOR 活化[1]。				
	Abemaciclib 对 A375R1-4、M14R 和 SH4R 有抑制作用, EC50 值范围为 0.3 至 0.6 μM; Abemaciclib 可抑制亲本 A375 和耐药 A375RV1 和 A375RV2 细胞的增殖, IC50 值分别为 395、260 和 463 nM, 效果相似[2]。				
	Abemaciclib 以低纳摩尔效力抑制 CDK4 和 CDK6, 抑制 Rb 磷酸化, 导致 G1 停滞和增殖抑制, 其活性特定于 Rb 熟练的细胞[3]。				
In Vivo	Abemaciclib (45 mg/kg, 口服) 与 RAD001 联合使用, 在 HNSCC 异种移植肿瘤中产生协同抗肿瘤作用[1]。				
	Abemaciclib (45 或 90 mg/kg, 口服) 在 A375 异种移植模型中表现出显著的肿瘤生长抑制作用[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 2.94 mg/mL (5.80 mM); 超声助溶 (<80°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 / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9740 mL	9.8699 mL	19.7398 mL
		5 mM	0.3948 mL	1.9740 mL	3.9480 mL
10 mM		---	---	---	
* 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 (protect from light)。-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:					
以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: 0.5% Hydroxyethyl cellulose in Water					
Solubility: 3.33 mg/mL (6.57 mM); 悬浊液; 超声助溶					



参考文献	[1]. Ku BM, et al. The CDK4/6 inhibitor LY2835219 has potent activity in combination with mTOR inhibitor in head and neck squamous cell carcinoma. Oncotarget. 2016 Mar 22;7(12):14803-13. [2]. Yadav V, et al. The CDK4/6 inhibitor LY2835219 overcomes PLX4032 resistance resulting from MAPK reactivation and cyclin D1 upregulation. Mol Cancer Ther. 2014 Oct;13(10):2253-63. [3]. Gelbert LM, et al. Preclinical characterization of the CDK4/6 inhibitor LY2835219: in-vivo cell cycle-dependent/independent anti-tumor activities alone/in combination with NSC 613327. Invest New Drugs. 2014 Oct;32(5):825-37. [4]. Solmaz Sahebjam et al. Assessment of concentrations of abemaciclib and its major active metabolites in plasma, CSF, and brain tumor tissue in patients with brain metastases secondary to hormone receptor positive (HR+) breast cancer. J Clin Oncol 34. 2016, 526-526.
------	--

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 (protect from light)。-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	1.9740 mL	9.8699 mL	19.7398 mL	49.3496 mL
	5 mM	0.3948 mL	1.9740 mL	3.9480 mL	9.8699 mL