



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: **Fadraciclib**
CAS 号: **1070790-89-4**
产品货号: **T19547**

生物活性:

Description	Fadraciclib (CYC065) is a second-generation, orally available ATP-competitive inhibitor of CDK2/CDK9 kinases[1] with IC50s of 5 and 26 nM, respectively[2].				
IC50 & Target	CDK2 CDK9				
In Vitro	Fadraciclib 可阻滞细胞周期中的 G1 期, 并特异性抑制 cyclin E1 (CCNE1) 高表达的子宫浆液性癌 (USC) 的细胞生长。与 CCNE1 低表达的 USC 细胞系相比, 体外实验中 CCNE1 高表达的 USC 细胞系对 Fadraciclib 更为敏感 (IC50: 高表达组为 124.1±57.8 nM, 低表达组为 415±117.5 nM, P=0.0003)。值得注意的是, 低浓度的 Fadraciclib (即 100 nM) 仅在 CCNE1 高表达的 USC 细胞系 (如 USC-ARK-2、USC-ARK-7) 中诱导细胞周期在 G1 期阻滞[1]。				
In Vivo	为评估 Fadraciclib 作为单药治疗的潜力, 对 USC-ARK-2 衍生的异种移植瘤进行每日 Fadraciclib (22.5 mg/kg) 治疗, 为期 3 周。每周记录两次肿瘤体积和小鼠体重。结果显示, 与对照组相比, Fadraciclib 的每日给药可显著抑制肿瘤生长 (从第 9 天起, P= 0.012)。在整个治疗期间未观察到显著体重下降[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (251.56 mM; 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	2.5156 mL	12.5780 mL	25.1560 mL
		5 mM	0.5031 mL	2.5156 mL	5.0312 mL
		10 mM	0.2516 mL	1.2578 mL	2.5156 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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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 (6.29 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 ddH₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。					



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

	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 (6.29 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 (6.29 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.29 mM); 澄清溶液
参考文献	[1]. Cocco E, et al. Dual CCNE1/PIK3CA targeting is synergistic in CCNE1-amplified/PIK3CA-mutated uterine serous carcinomas in vitro and in vivo. Br J Cancer. 2016 Jul 26;115(3):303-11. [2]. Sumana Devata, et al. Molecular markers and venous thromboembolism (VTE) in acute myelogenous leukemia (AML)

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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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	2.5156 mL	12.5780 mL	25.1560 mL	62.8899 mL
	5 mM	0.5031 mL	2.5156 mL	5.0312 mL	12.5780 mL
	10 mM	0.2516 mL	1.2578 mL	2.5156 mL	6.2890 mL
	15 mM	0.1677 mL	0.8385 mL	1.6771 mL	4.1927 mL
	20 mM	0.1258 mL	0.6289 mL	1.2578 mL	3.1445 mL
	25 mM	0.1006 mL	0.5031 mL	1.0062 mL	2.5156 mL
	30 mM	0.0839 mL	0.4193 mL	0.8385 mL	2.0963 mL
	40 mM	0.0629 mL	0.3144 mL	0.6289 mL	1.5722 mL
	50 mM	0.0503 mL	0.2516 mL	0.5031 mL	1.2578 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

	60 mM	0.0419 mL	0.2096 mL	0.4193 mL	1.0482 mL
	80 mM	0.0314 mL	0.1572 mL	0.3144 mL	0.7861 mL
	100 mM	0.0252 mL	0.1258 mL	0.2516 mL	0.6289 mL



源叶