



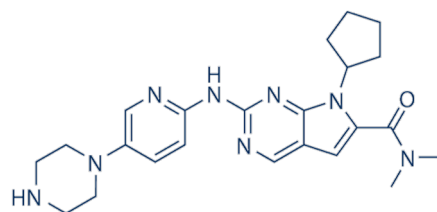
## LEE011 (CDK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6668-10mM	LEE011 (CDK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6668-5mg	LEE011 (CDK抑制剂)	5mg
SC6668-25mg	LEE011 (CDK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	7-cyclopentyl-N,N-dimethyl-2-[(5-piperazin-1-ylpyridin-2-yl)amino]pyrrolo[2,3-d]pyrimidine-6-carboxamide
简称	LEE011
别名	Ribociclib, LEE-011, LEE 011
中文名	N/A
化学式	C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>8</sub> O
分子量	434.54
CAS号	1211441-98-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 7mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.15ml DMSO, 或每4.35mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6668-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Ribociclib (LEE011)是一种口服具有活性的, 高度特异性CDK4/6抑制剂。Phase 3。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	CDK4	CDK6	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	LEE011是一种CDK4/CDK6的双重抑制剂, 能够显著抑制17种神经细胞瘤中的12种的生长, 平均IC50值是307nM。对神经细胞瘤的抑制主要是抑制细胞的生长, 受到G1细胞周期阻滞和细胞衰老的调控。				
体内研究	LEE011(200mg/kg 每日, 口服)引起小鼠中的BE2C或者1643细胞显著的生长延迟, 没有体重减轻或者其它的毒性症状。				
临床实验	N/A				
特征	口服生物有效的CDK4/6选择性抑制剂, 处于III期临床测试, 用于晚期乳腺癌的治疗。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	BE2C, IMR5, 1643, SY5Y, CHP134, SKNSH, ngP, KELLY, LAN5, NLF, NB69, SKNDZ, NBSD, NBL5, SKNFI, EBC1, SKNAS, NB16, RPE1细胞系。
浓度	10μM
处理时间	~100小时
方法	将板中优先附着基底生长的神经母细胞瘤细胞系以一式三份种植于Xcelligence实时细胞电子传感系统, 用4个剂量梯度的抑制剂和DMSO为对照处理细胞24小时。连续监测细胞约100个小时, IC50通过以下方法测得: 通过绘制细胞指数为时间的函数产生生长曲线, 以在治疗开始时细胞指数为1作为标准。从治疗开始到处理96小时后, 生长曲线下的面积通过基线下面积为1(治疗开始时的细胞指数)进行计算。积分面积以DMSO处理的对照组作为背景。抑制剂比上对照组的值取非线性对数值来计算。所有的实验至少重复一次。

动物实验
------

动物模型	BE2C、NB-1643或EBC1异种移植的小鼠。
配制	0.5%甲基纤维素
剂量	~200毫克/千克每天
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

1.Rader J, et al. Clin Cancer Res. 2013, 19(22), 6173-6182.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC6668-10mM	LEE011 (CDK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6668-5mg	LEE011 (CDK抑制剂)	5mg
SC6668-25mg	LEE011 (CDK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01