

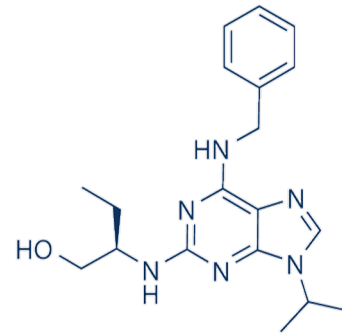
Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0101-10mM	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0101-5mg	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2 抑制剂)	5mg
SC0101-25mg	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(2R)-2-[[6-(benzylamino)-9-propan-2-yl]purin-2-yl]amino]butan-1-ol
简称	Roscovitine
别名	Seliciclib, CYC202, CYC 202, CYC-202, R-roscovitine
中文名	细胞周期蛋白B激酶抑制剂
化学式	C ₁₉ H ₂₆ N ₆ O
分子量	354.45
CAS号	186692-46-6
纯度	100.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 71mg/ml; Ethanol 6mg/ml
溶液配制	5mg加入1.41ml DMSO, 或者每3.54mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0101-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Roscovitine(Seliciclib, CYC202)是一种有效的, 选择性CDK抑制剂, 作用于Cdc2、CDK2和CDK5时, 无细胞试验中IC50分别为0.65μM、0.7μM和0.16μM, 对CDK4/6几乎没有作用。Phase 2。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	CDK5/p35	Cdc2/CyclinB	CDK2/CyclinA	CDK2/CyclinE	ERK2
IC50	0.16μM	0.65μM	0.7μM	0.7μM	14μM
体外研究	Roscovitine作用于细胞周期蛋白依赖性激酶具有高效性和高度选择性, 作用于cdc2/cyclin B、cdk2/cyclin A、cdk2/cyclin E和cdk5/p53时IC50分别为0.65、0.7、0.7和0.16μM。纳摩尔级Roscovitine作用于海星卵母细胞和海胆胚胎, 可逆抑制在前中期间转变, 在体外作用于非洲爪蟾卵提取物, 抑制M期促进因子活性和体外DNA合成, 且抑制哺乳动物细胞系增殖, IC50为16μM。浓度为7.5、12.5和25mM的 Roscovitine作用于肾小球系膜细胞, 导致CDK2活性分别降低25%、50%和100%, 这种作用存在剂量依赖性。最新研究显示Roscovitine作用于盘基网柄菌, 抑制cdk5激酶活性, 细胞增殖, 多细胞发展和cdk5核转运, 不会影响cdk5蛋白表达。				
体内研究	Roscovitine按50mg/kg剂量作用于Ewing's肉瘤家族(ESFT)移植瘤, 明显抑制肿瘤生长。Roscovitine作用于携带MCF7移植瘤的裸鼠, 增强抗癌Doxorubicin抗癌效果, 不会提高毒性, 机制是使细胞周期停滞而不是引起凋亡。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	激酶活性实验在30°C下buffer C中进行。从数据中除去空白值, 在10分钟的温育期中测定渗透到蛋白受体中的磷酸摩尔数, 来计算活性。对照组用适当稀释的DMSO处理。在一些情况下, SDS/PAGE后通过自动射线照相术测定底物磷酸化。p34 ^{cdc2} /cyclin B通过亲和色谱从 M期海星卵母细胞中纯化。使用1mg组蛋白H1/ml, 在15μM [γ- ³² P]ATP存在时进行实验, 终浓度为30μl。在30°C下温育10分钟, 25μl上清液 转移到Whatman P81磷酸纤维素纸上, 20秒后, 用10ml磷酸/L水冲洗过滤器5次, 每次至少5分钟。湿式过滤器转移到6ml闪烁管, 加入5ml ACS闪烁液, 使用Packard计数器测定放射性。测定在10分钟温育期中组蛋白H1渗透放入磷酸摩尔数评估激酶活性或者最大活性百分数。感染不同杆状病毒的sf9昆虫细胞抽提物中再生p33 ^{cdk2} /cyclin A和p33 ^{cdk2} /cyclin E。Cyclins A和E是谷胱甘肽S-转移酶融合蛋白, 复合体从谷胱甘肽-琼脂糖珠上纯化。使用1mg/ml组蛋白H1/ml, 在15μM[γ- ³² P]ATP存在时, 进行激酶活性实验10分钟, 终体积为

	30 μ l, 测定p34 ^{cdc2} /cyclin B激酶。p33 ^{cdk5} /p35从牛脑中纯化, 除了Mono S-色层分离一步法。Superose 12柱的活性片段汇集, 终浓度为25 μ g/ml。使用1mg/ml组蛋白H1, 在15 μ M[γ - ³² P]ATP存在时, 进行激酶活性实验10分钟, 终体积为30 μ l, 测定p34cdc2/cyclin B激酶。
--	--

细胞实验	
细胞系	白血病、非小细胞肺癌、结肠癌、中枢神经系统肿瘤、恶性黑色素瘤、卵巢癌、肾癌、前列腺癌、胸腺癌细胞系
浓度	0.01到100 μ M
处理时间	48小时
方法	包括9种肿瘤类型的60种人类肿瘤细胞系培养24小时, 然后用0.01-100 μ M Roscovitine持续处理48小时。进行sulforhodamine B蛋白实验测评毒性。

动物实验	
动物模型	右后侧皮下注射A4573细胞的CD1 nu/nu鼠
配制	Roscovitine溶于无水甲醇或DMSO, 然后用10% Tween-80、20% N-N-二甲基乙酰胺和70% PEG400稀释
剂量	\leq 50mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ 参考文献:

1. Meijer L, et al. Eur J Biochem. 1997; 243(1-2):527-536.
2. Pippin JW, et al. J Clin Invest. 1997; 100(10):2512-2520.
3. Tirado OM, et al. Cancer Res. 2005; 65(20); 9320-9327.
4. Appleyard MV, et al. Int J Cancer. 2009; 124(2):465-472.
5. Huber RJ, et al. J Cell Biochem. 2012; 113(3):868-876.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0101-10mM	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC0101-5mg	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2抑制剂)	5mg
SC0101-25mg	Roscovitine (Seliciclib, CYC202) (CDK2抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存, 至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月内有效。

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降于管底后再开盖使用。
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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其它相关文献, 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的等效剂量转换表请参考如下网页: <http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.08.16