

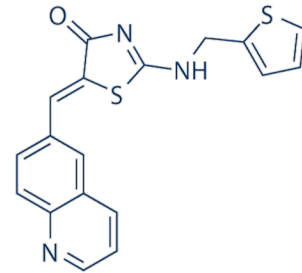
RO-3306 (CDK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6673-10mM	RO-3306 (CDK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6673-5mg	RO-3306 (CDK抑制剂)	5mg
SC6673-25mg	RO-3306 (CDK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(5Z)-5-(quinolin-6-ylmethylidene)-2-(thiophen-2-ylmethylamino)-1,3-thiazol-4-one
简称	RO-3306
别名	RO 3306, RO3306, Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₁₃ N ₃ OS ₂
分子量	351.45
CAS号	872573-93-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 13mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.42ml DMSO, 或每3.51mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6673-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	RO-3306是一种ATP竞争性的选择性CDK1抑制剂, Ki为20nM, 选择性是其他各种人类激酶的15倍多。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	CDK1	PKCδ	SGK	ERK	PKA
IC50	20nM(Ki)	318nM(Ki)	497nM(Ki)	1980nM(Ki)	>2000nM(Ki)
体外研究	RO-3306抑制CDK1/cyclin B1、CDK1/cyclin A、CDK2/cyclin E和CDK4/cyclin D活性, Ki分别为35nM、110nM、340nM和>2000nM。HCT116、SW480和HeLa细胞用RO-3306处理20小时导致细胞周期完全阻滞在G2/M期。HCT116和SW480的增殖被RO-3306有效阻断。RO-3306似乎在癌细胞(HCT116和SW480)中比在非致瘤性细胞(MCF 10A和MCF 12A)中具有更强的促凋亡作用。10μM浓度的RO-3306有效阻止卵母细胞成熟。				
体内研究	N/A				
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	CDK1 cyclin B1, CDK1 cyclin A, CDK2 cyclin E和CDK4 cyclin D通过均相时间分辨荧光法在96孔格式中测量。实验缓冲液包含25mM Hepes, 6.25mM MgCl ₂ , 0.003% Tween 20, 0.3mg/ml BSA, 1.5mM DTT和如下含量的ATP: 162μM(CDK1), 90mM(CDK2), 或135μM(CDK4)。CDK1和CDK2缓冲液包含10mM MgCl ₂ 。测试化合物在20μl实验缓冲液中稀释为它们终浓度的3倍, 反应通过加入40μl包含pRB底物(0.185μM)的试验缓冲液起始。板在37°C下连续搅拌培养30分钟, 反应通过加入15μl含1.6μM抗磷酸pRB抗体(Ser-780)的25mM Hepes, 24mM EDTA和0.2mg/ml BSA终止。再振荡培育30分钟后, 加入15μl包含3nM Lance-Eu-W1024-labeledanti-rabbitIgG和60nM Alophycocyanin共轭的抗-His-6 抗体的25mM Hepes, 以及0.5mg/ml BSA, 培育1小时。板在Victor-V多标阅读器上以340nm激发波长和615nm与665nm发射波长读取数据。IC50值根据665nm下的读数进行计算, 并归一化为615nm下的读数。Ki值根据公式 $K_i = IC_{50} / (1 + S / K_m)$ 计算, 其中S是试验中ATP浓度, K _m 是相对ATP的Michaelis-Menten常数。对激酶组的抑制活性通过IMAP测定技术确定。

细胞实验	
细胞系	MDA-MB-231细胞系
浓度	20 μ M
处理时间	72h
方法	对数生长期细胞(25,000)接种于96孔板, 在37°C培养箱中与CO ₂ 一起培养, 24小时后, 给予不同浓度RO-3306以测定达到50%生长抑制(IC50)的药物浓度。MTT(20 μ l, 包含5mg/ml储备溶液的生理盐水)加入每孔中, 细胞培养4小时。移除上清液, 来自活细胞的甲瓚晶体溶解在200 μ l无水DMSO中。吸光度使用550模式酶标仪在565nm波长下检测。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

- 1.Vassilev LT, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 2006, 103(28), 10660-10665.
- 2.Jang WI, et al. Anim Reprod Sci. 2014, 144(3-4), 102-108.
- 3.Xia Q, et al. Int J Oncol. 2014, 44(3), 735-744.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6673-10mM	RO-3306 (CDK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6673-5mg	RO-3306 (CDK抑制剂)	5mg
SC6673-25mg	RO-3306 (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:

- 本产品对人体有毒, 操作时请特别小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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