

## Seliciclib(Roscovitrine,CYC202)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Seliciclib(Roscovitrine,CYC202)	51103ES08	5mg
Seliciclib(Roscovitrine,CYC202)	51103ES25	25mg

### 产品描述

Seliciclib (Roscovitrine, CYC202) 是一种强效的、高度选择性cdk抑制剂, 作用于cdc2/cyclin B, cdk2/cyclin A, cdk2/cyclin E和cdk5/p53, IC<sub>50</sub>分别为0.65, 0.7, 0.7和0.16 μM。Seliciclib抑制非洲爪蟾卵提取物中M期促进因子活性和体外DNA合成, 可以抑制黄体酮诱导的卵母细胞突变, 并抑制体内延伸因子eEF-1磷酸化。在DNA修复机制研究中, Seliciclib单独作用不能降低cyclin A1转录水平, 但可以降低蛋白表达。当与DNA损伤药物同时使用时, Seliciclib可以阻止DNA损伤诱导的cyclin A1上调, 包括转录和翻译水平。临床前研究表明, Seliciclib在体内外多种人癌细胞的研究中都表现出显著的抗肿瘤作用。Roscovitrine已经用于NSCLC, 白血病, HIV感染, 单纯疱疹感染和囊性纤维化的临床实验中。

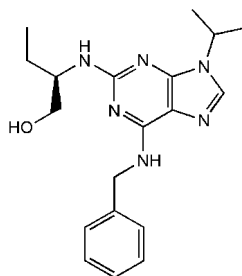
目前, Seliciclib(Roscovitrine,CYC202)以用于临床 Phase 2 阶段。

**【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】**

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Roscovitrine, R-roscovitrine, CYC202
化学名 (Chemical Name)	2-(R)-(1-Ethyl-2-hydroxyethylamino)-6-benzylamino-9-isopropylpurine
靶点 (Target)	Cdc2, CDK2, CDK5
CAS 号 (CAS NO.)	186692-46-6
分子式 (Molecular Formula)	C <sub>19</sub> H <sub>26</sub> N <sub>6</sub> O
分子量 (Molecular Weight)	354.45
外观 (Appearance)	白色粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输与保存方法

粉末直接保存于-20 ℃, 有效期 2 年。易溶于 DMSO。建议分装后-20 ℃ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

### 注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

## 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

## 相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### （一）细胞实验

- 1) 为检测Roscovitine对CDK2活性的作用，分别用Roscovitine(7.5, 12.5, 25  $\mu$ M)孵育血管系膜细胞，组蛋白H1激酶实验结果显示，Roscovitine以剂量依赖的方式降低CDK2活性，在7.5和12.5 $\mu$ M时，Roscovitine分别降低25%和50%CDK2活性，25 $\mu$ M Roscovitine则完全抑制CDK2活性。Roscovitine还以浓度依赖的方式抑制DNA合成，并抑制细胞增殖。<sup>[2]</sup>
- 2) 为检测Roscovitine对细胞生长的作用，用roscovitine (10 $\mu$ M)孵育3种EWS (TC-71, SK-ES-1, A4573)和2种PNET (SK-N-MC和TC-32)细胞24 hours。Roscovitine显著抑制细胞增殖(约60%)，诱导细胞死亡(>35%)。在进一步对EWS研究中，roscovitine (10 $\mu$ M)诱导TC-71和SK-ES-1细胞G1期细胞捕获。<sup>[3]</sup>

### （二）动物实验

- 1) 为检测 Roscovitine 在大鼠体内对系膜细胞增殖的作用，每天给大鼠腹腔注射 2.8 mg/kg 体重的 Roscovitine，Thy 1 大鼠中 CDK2 活性明显降低，而且 Roscovitine 处理的 Thy 1 大鼠血管系膜细胞增殖降低。<sup>[2]</sup>
- 2) 为检测 Roscovitine 在体内对肿瘤生长的作用，建立 A4573 肿瘤细胞小鼠移植瘤模型，给小鼠腹腔注射 50 mg/kg Roscovitine，与对照组相比，Roscovitine 处理的小鼠中肿瘤生长速度明显降低。<sup>[3]</sup>

## 参考文献

- [1] Meijer, L., et al. Biochemical and cellular effects of roscovitine, a potent and selective inhibitor of the cyclin-dependent kinases cdc2, cdk2 and cdk5. *Eur J Biochem.* 243(1-2): 527-536(1997).
- [2] Pippin, J.W., et al. Direct in vivo Inhibition of the Nuclear Cell Cycle Cascade in Experimental Mesangial Proliferative Glomerulonephritis with Roscovitine, a Novel Cyclin-dependent Kinase Antagonist. *J Clin Invest.* 100(10): 2512-2520(1997).
- [3] Tirado, O.M., et al. Roscovitine Is an Effective Inducer of Apoptosis of Ewing's Sarcoma Family Tumor Cells In vitro and In vivo. *Cancer Res.*, 65(20): 9320-9327(2005).
- [4] Mario Federico, et al. R-Roscovitine (Seliciclib) prevents DNA damage-induced cyclin A1 upregulation and hinders non-homologous end-joining (NHEJ) DNA repair. *Molecular Cancer* 9:208(2010).