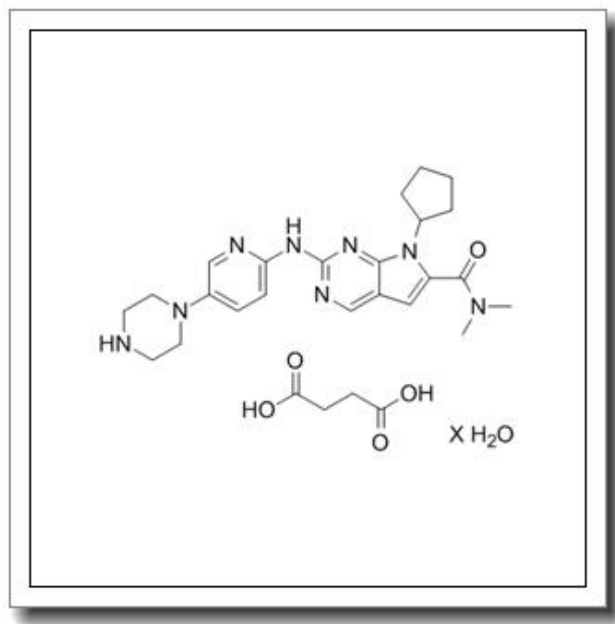


瑞博西尼

LEE011 succinate hydrate



产品基本信息

属性	值
化学名称	LEE011 succinate hydrate
中文名称	瑞博西尼
CAS 号	1374639-79-8
分子式	C ₂₇ H ₃₈ N ₈ O ₆
分子量	570.641
纯度	≥ 96%

产品说明

1. 产品概述与化学特性

LEE011 succinate hydrate (瑞博西尼) 是一种高选择性细胞周期蛋白依赖性激酶 4/6 (CDK4/6) 抑制剂, 化学名称为 2-乙酰基-5-(5-(4-甲基哌嗪-1-基)吡啶-2-基)氨基)-N-(5-(1,1-二甲基乙基)-1H-吡唑-3-基)吡啶-3-甲酰胺琥珀酸盐一水合物。其分子式为 C₂₇H₃₈N₈O₆, 分子量为 570.641, CAS 号为 1374639-79-8。本品为白色至类白色结晶性粉末, 纯度 ≥96%, 易溶于二甲基亚砷 (DMSO), 微溶于水和乙醇。

2. 生物化学功能与重要性

瑞博西尼通过特异性抑制 CDK4/6 激酶活性, 阻断细胞周期 G1 期向 S 期过渡, 从而抑制肿瘤细胞增殖。该机制在激素受体阳性 (HR+) 乳腺癌治疗中具有关键作用, 可显著增强内分泌疗法的疗效。其琥珀酸盐形式提高了药物的溶解性和生物利用度, 而一水合物结构确保了储存稳定性。

3. 主要应用领域与具体用途

本品主要用于抗肿瘤药物研发, 尤其适用于 HR+/HER2-晚期乳腺癌的临床前研究及联合用药方案开发。在体外实验中, 常用于细胞增殖抑制实验、激酶活性检测及信号通路研究; 在体内模型中, 可用于评估药效学与药代动力学特性。此外, 还可作为标准品用于质控分析和代谢研究。

4. 储存条件与使用建议

建议避光保存于 -20℃ 干燥环境中, 长期储存需置于惰性气体保护下。使用时需平衡至室温后称量, 避免反复冻融。溶解推荐使用 DMSO 配制母液 (浓度 ≤10 mM), 后续用缓冲液稀释至工作浓度。实验操作需在生物安全柜中进行, 避免直接接触皮肤或吸入粉尘。

5. 质量控制与安全信息

本产品经 HPLC 验证纯度 ≥96%, 水分含量 ≤5.0%, 重金属残留符合 USP 标准。安全数据表明, 其属于有害化学品, 可能引起眼睛和皮肤刺激。操作时应穿戴防护装

备, 包括手套、护目镜及实验服。废弃物需按危险化学品规范处置。详细毒理学数据可参考材料安全数据表 (MSDS)。