

PD-0325901 ; PD0325901

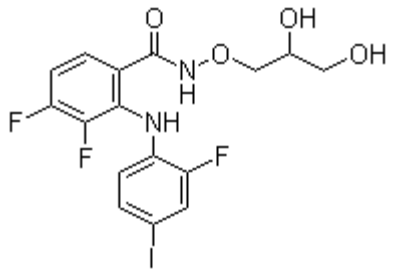
产品编号：MB1886

质量标准：>99%,ATP 非竞争性的 MEK 抑制剂

包装规格：10MG;100MG

产品形式：白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C16H14F3IN2O4	结构式	
分子量	482.19		
CAS No.	391210-10-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 20 mg/mL Water Insoluble Ethanol : 40 mg/mL (82.95 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：PD0325901 是一种具有选择性的，ATP 非竞争性的 **MEK** 抑制剂，**IC₅₀** 值为 0.33 nM，是 CI-1040 对 ERK1 和 ERK2 磷酸化作用的 500 多倍。

别名：N-[(2R)-2,3-Dihydroxypropoxy]-3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-iodophenyl)amino]-benzamide ; PD-0325901 ; PD0325901

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO: 20 mg/mL ; Water Insoluble ; Ethanol : 40 mg/mL (82.95 mM)

含量：.....>99%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PD0325901 (PD325901)是选择性的，ATP 非竞争性的 MEK 抑制剂，IC ₅₀ 为 0.33 nM，比 CI-1040 作用于 ERK1 和 ERK2 磷酸化效果高 500 倍左右。
靶点	MEK (Cell-free assay)
IC₅₀	0.33 nM
体外研究	PD0325901 比另一种 MEK 抑制剂 CI-1040 具有更高的渗透率。与 CI-1040 相比，PD0325901 可以到达体系的更深层。PD0325901 是非 ATP 竞争性的 MAPK 激酶 MEK 抑制剂，抑制鼠类结肠 26 细胞的 MEK 时 IC ₅₀ 为 0.33nM。苏氨酸/酪氨酸激酶 MEK 是 RAS/RAF/MEK/ERK 信号通路的关键组成部分，在人类肿瘤细胞中通常是激活的。PD0325901 精确有效地抑制 MEK，作用于 MEK1 和 MEK2 时 Ki 值为 1nM。PD0325901 作用于细胞 ERK1 和 ERK2 的磷酸化效果比 CI-1040 强到大约 500 倍。
体内研究	PD0325901 阻止细胞黑色素瘤细胞系的生长，使异种移植鼠模型的细胞周期停止在 G1

期,引起细胞凋亡单独口服 25 mg/kg PD032590124 后, ERK 的磷酸化作用被阻断达到 50%以上。PD 0325901 的抗癌活性已经被用于更广泛的人类移植瘤的研究中,在研究的人类肿瘤模型中,有 6/7 被 PD 0325901 明显抑制。PD0325901 抑制恶性黑色素瘤细胞系生长。PD0325901 抑制 TPC-1 细胞和 K2 细胞生长,GI50 分别为 11 和 6.3 nM。PD0325901 浓度非常低时(10 nM)也明显抑制携带 BRAF 突变的 PTC 细胞生长,且同样浓度时只稍微提高携带 RET/PTC1 重排的 PTC 细胞生长。PD0325901 作用于多种 PTC 细胞系,有效抑制 ERK1/2 磷酸化。

美仑相关产品推荐

MB5452	PD184352 (CI-1040)
MB4068	PD318088
MB5132	PD98059
MB4064	Pimasertib (AS-703026)
MB3241	Selumetinib (AZD6244)
MB9629	SL-327
CL-10319	TAK-733
MB5401	Trametinib (GSK1120212)
MB4063	U0126-EtOH

用途及描述 : 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。PD 0325901 是一种有效的 MKK1 (MEK1)和 MKK2 (MEK2)抑制剂。MEK1 和 MEK2 的 Ki 分别为 1.1 和 0.79 nM。PD 0325901 对其他 27 种激酶无效。当剂量为 25 mg/kg 时, PD 0325901 对小鼠 C26 肿瘤振作抑制 75%。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0739 mL	10.3694 mL	20.7387 mL
5 mM	0.4148 mL	2.0739 mL	4.1477 mL
10 mM	0.2074 mL	1.0369 mL	2.0739 mL
50 mM	0.0415 mL	0.2074 mL	0.4148 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	体外级联实验: 在有含 p44MAPK(GST-MAPK)的谷胱甘肽 S-转移酶融合蛋白和含 p45MEK(GST-MEK)的谷胱甘肽 S-转移酶融合蛋白存在情况下, 测定 ³² P 渗透到髓鞘碱性蛋白(MBP)的渗透率。实验溶液包括 20 mM HEPES,pH 为 7.4,10 mM MgCl ₂ ,1 mM MnCl ₂ ,1 mM EGTA,50 mM [gamma- ³² P]ATP,10 mg GST-MEK,0.5 mg GST-MAPK,和 40 mg MBP 终体积为 100 mL。实验进行 20 分钟后,加入三氯乙酸终止反应,然后通过 GF/C 过滤器过滤。使用 1205 Beta 板测定保留在过滤器中的 ³² P。测定不同剂量 PD0325901, 绘制剂量反应曲线。
细胞实验 :	Cell lines: PTC 细胞 Concentrations: 0.1 nM- 1 μM Incubation Time: 48 小时

	<p>Method: 1×10⁴个 PTC 细胞接种在含 1mL 培养基的 24 孔板上，在 37°C 下温育 4 天。在实验第一天加入不同浓度 MEK 抑制剂，重复三次。MTT 溶于 0.8% NaCl 溶液，浓度为 5 mg/mL，实验第三天，每孔加入 0.2 mL，测定 GI50 或者测定每天的细胞生长曲线。细胞和 MTT 在 37°C 下温育 3 小时。然后从孔中吸出液体除去。染色的细胞溶于 0.5 mL DMSO 然后使用 Synergy HT 增殖酶标仪在 570 nm 处测定吸光值。然后测定 GI50，按公式 $100 \times (T - T_0) / (C - T_0)$ 计算细胞生长。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 携带 PTC 细胞的 Ncr-nu/nu 鼠 Formulation: 80 mM 柠檬酸缓冲液(pH 7) Dosages: 20-25 mg/kg Administration: 口服饲喂</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。