

Vemurafenib ; PLX 4032 ; 维罗非尼 ; RG7204

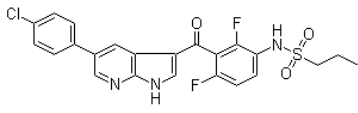
产品编号 : MB2102

质量标准 : >98.5%,B-Raf 突变抑制剂

包装规格 : 10MG;100MG;1G

产品形式 : 类白色粉末

基本信息

分子式	C23H18ClF2N3O3S	结构式	
分子量	489.92		
CAS No.	918504-65-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 97 mg/mL (197.99 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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: 维罗非尼 Vemurafenib 是一种新颖的, 有效的 **B-RAF** 抑制剂, 能够抑制 RAF^{V600E} 和 c-RAF-1 的活性, IC_{50} 分别为 31 nM 和 48 nM。

别名: 维罗非尼;PLX-4032; RG7204; R7204; RO5185426;

PLX4032;N-[3-[[5-(4-Chlorophenyl)-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-yl]carbonyl]-2,4-difluorophenyl]-1-propanesulfonamide

物理性状及指标 :

外观 :类白色粉末

熔点 :262-275°C

溶解性 :溶于 DMSO (100 mg/mL)和甲醇 ; 不溶于乙醇和水

密度 :1.47 g/cm³ (预测)

IC_{50} :B-Raf^{V600E}: IC_{50} = 31 nM; C-Raf: IC_{50} = 48 nM; MAP4K5 (KHS1): IC_{50} = 51 nM;

.....SRMS: IC_{50} = 18 nM; ACK1: IC_{50} = 19 nM; FGR : IC_{50} = 63 nM

储存条件: -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Vemurafenib (PLX4032, RG7204)是一种新型有效的 B-Raf^{V600E} 抑制剂, IC_{50} 为 31 nM。Vemurafenib 对 B-Raf^{V600E} 的选择性比对野生型 B-Raf 的选择性高 10 倍, 在细胞实验中, 选择性可高 100 倍以上。				
特性	PLX4032 是新型有效的 B-RAF ^{V600E} 肿瘤蛋白抑制剂。				
靶点	SRMS (Cell-free assay)	ACK1 (Cell-free assay)	B-Raf (V600E) (Cell-free assay)	C-Raf (Cell-free assay)	MAP4K5 (KHS1) (Cell-free assay)

	18 nM	19 nM	31 nM	48 nM	51 nM
体外研究	PLX4032 抑制 B-RAF ^{V600E} , C-RAF, 和 野生型 B-RAF, IC50 分别为 31 nM, 48 nM, 和 100 nM。PLX4032 也抑制一些非-RAF 激酶,包括 ACK1, KHS1,和 SRMS, IC50 为 18 nM 到 51 nM。PLX4032 作用于黑色素瘤细胞系, 抑制效果依赖于 B-RAF 突变状态, 因为 PLX4032 有效抑制含 B-RAF ^{V600E} 突变的细胞, 包括 V600E, V600D, V600K, 和 V600R, 但是对野生型或其他突变没有作用效果。PLX4032 作用于 MALME-3M, Colo829, Colo38, A375, SK-MEL28, 和 A2058 细胞时, IC50 为 20 nM 到 1 μM。0.1 μM 到 30 μM PLX4032 也抑制 MEK1/2 和 ERK1/2 磷酸化作用。PLX4032 高效作用于黑色素瘤的治疗 因为 PLX4032 有效抑制 B-RAF ^{V600E} 。PLX4032 作用于结肠癌细胞, 抑制 B-RAF ^{V600E} 导致 EGFR 激活的快速回应, 可用于补偿 PLX4032 抑制的细胞增殖。				
体内研究	PLX4032 按 6 mg/kg-20 mg/kg 剂量作用于 B-RAF ^{V600E} -突变鼠移植瘤模型, 抑制肿瘤生长。PLX4032 按 12.5 mg/kg-100 mg/kg 剂量作用于携带 LOX, Colo829, 和 A375 移植瘤小鼠, 抑制肿瘤生长, 延长小鼠寿命。				

美仑相关产品推荐

CL-10328	GDC-0879
MB5133	PLX4720
CL-10148	RAF265 (CHIR-265)
CL-10173	Raf265 derivative
MB4070	SB590885

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。维罗非尼是一种新型的、有效的 B-RAF^{V600E} 抑制剂, 有抑制肿瘤生长的作用。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0411 mL	10.2057 mL	20.4115 mL
5 mM	0.4082 mL	2.0411 mL	4.0823 mL
10 mM	0.2041 mL	1.0206 mL	2.0411 mL
50 mM	0.0408 mL	0.2041 mL	0.4082 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	RAF 激酶活性测定: 通过测量生物素化的 BAD 蛋白磷酸化而测定野生型 RAF 和突变型的激酶活性。在 20 mM Hepes (pH 7.0), 10 mM MgCl ₂ , 1 mM DTT, 0.01% (v/v) Tween-20, 50 nM 生物素-BAD 蛋白, 和 1 mM ATP 的混合物中室温下进行反应。加入 5 μL 含 20 mM Hepes (pH 7.0), 200 mM NaCl, 80 mM EDTA, 0.3% (w/v) 牛血清蛋白 (BSA) 的溶液, 5 分钟后, 反应终止。终止溶液也包含 p-BAD (Ser112) 抗体, 链霉亲和素包被的供体小珠, 蛋白 A 受体小珠。抗体和小珠在终止溶液中黑暗环境下室温预温育 30 分钟。最终抗体被稀释 2000 倍, 每个小珠的终浓度为 10 μg/mL。重复做三次单独纯化蛋白实验, 去不同两批的平均值作为突变活性。
---------------	---

细胞实验：	Cell lines: MALME-3M, Colo829, Colo38, A375, SK-MEL28, 和 A2058 细胞 Concentrations: 0–10 μ M, 溶于 DMSO Incubation Time: 5 天 Method: 通过 MTT 实验测评细胞增殖。细胞按每孔 1000 到 5000 个接种在 96 孔板上, 体积为 180 μ L。PLX4032 按最终实验浓度的 10 倍储备在含 1% DMSO 的培养基中。细胞接种 24 小时后, 加入 20 μ L 适当稀释的 PLX4032。接种 6 天后, 进行增殖实验。计算抑制百分数, 根据抑制百分数与浓度的对数的回归分析测定 IC50 值。
动物实验：	Animal Models: 携带 LOX, Colo829, 和 A375 移植瘤细胞的无胸腺裸鼠 Formulation: 配制成微沉淀散粉 (MBP), 按指定浓度悬浮在含 2% Klucel LF 的水溶液中, 然后使用 HCl 调节 pH 为 4 Dosages: 12.5 mg/kg–100 mg/kg Administration: 口服饲喂, 每天两次

【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。