

SCH-772984 ; SCH772984

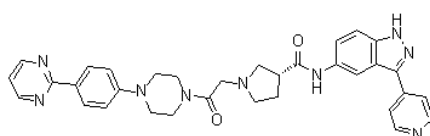
产品编号 : MB3432

质量标准 : >98% , ERK1/2 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C33H33N9O2	结 构 式	
分子量	587.67		
CAS No.	942183-80-4		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 14 mg/mL warmed (23.82 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 : SCH772984 有效抑制 ERK1 和 ERK2 活性, IC₅₀ 分别为 4 和 1 nM。

别名 : 3-Pyrrolidinecarboxamide, 1-[2-oxo-2-[4-[4-(2-pyrimidinyl)phenyl]-1-piperazinyl]ethyl]-N-[3-(4-pyridinyl)-1H-indazol-5-yl]-, (3R)-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄至黄色粉末

溶解性 :DMSO 14 mg/mL warmed (23.82 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	SCH772984 是一种新型特异性的 ERK1/2 抑制剂, 无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 4 nM 和 1 nM, 对含有 RAS 或 BRAF 突变的癌细胞具有强大的功效。	
特性	SCH772984 不直接抑制 MEK1, MEK2, BRAF, 或 CRAF 酶活性。	
靶点	ERK2 (Cell-free assay)	ERK1 (Cell-free assay)

	1 nM	4 nM
体外研究	SCH772984 是新型, 选择性, ATP 竞争性的 ERK1/2 抑制剂。SCH772984 抑制 ERK 底物 p90 核糖体 S6 激酶 (T359/S363 磷酸化-RSK) 的磷酸化, 这种作用存在剂量依赖性。SCH772984 也能抑制 ERK 自身活化环中残基的磷酸化。SCH772984 分别抑制约 88%和 49% BRAF 突变型或 RAS-突变型肿瘤细胞系, EC50 值 < 500 nM。	
体内研究	SCH772984 按耐受剂量处理移植瘤模型, 诱导肿瘤衰退。SCH772984 作用于抗 BRAF 或 MEK 抑制剂的模型, 有效抑制 MAPK 信号和细胞增殖。	

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5899	GDC0994
MB3652	TIC10 Analogue

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。SCH772984 是一种新型特异性的 **ERK1/2** 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 分别为 4 nM 和 1 nM, 对含有 RAS 或 BRAF 突变的癌细胞具有强大的功效。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7016 mL	8.5082 mL	17.0164 mL
5 mM	0.3403 mL	1.7016 mL	3.4033 mL
10 mM	0.1702 mL	0.8508 mL	1.7016 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>ERK2 IMAP 酶实验: SCH772984 作用于纯化的 ERK2 或 ERK1, 按一式两份进行 8 点稀释曲线。酶添加到实验板中。与化合物温育, 然后加入底物肽和 ATP 溶液中。384 孔板中每孔加入 14μl 稀释的酶 (每组反应含 0.3ng 活性 ERK2)。实验板轻轻震荡混合试剂, 然后在室温下温育 45 分钟。加入 60μl of IMAP 结合溶液 (IMAP 珠在 1X 结合缓冲液中按 1:2200 稀释) 终止反应。实验板在室温下再温育 0.5 小时, 使磷酸肽与 IMAP 珠完全结合。然后在 LJI 分析仪上读数。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: BRAF 突变型或 RAS 突变型肿瘤系 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 5 天 Method: 在 96 孔板中进行细胞增殖实验, 细胞按每孔 4,000 个的密度接种。接种 24 小时后, 使用</p>

	DMSO 处理细胞，9 点 IC50 稀释 (0.001-10 μ M)，DMSO 终浓度为 1%。使用 ViaLight 发光试剂盒 5 天后，测定存活力。细胞系存活力检测中，使用 SCH772984 处理细胞 4 天，然后进行 CellTiterGlo 发光细胞活力检测。
动物实验：	Animal Models: 裸鼠 Formulation: -- Dosages: 12.5 mg/kg, 25 mg/kg, 50 mg/kg Administration: 腹腔注射

【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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。