

Cobimetinib ; RG7420 ; GDC-0973

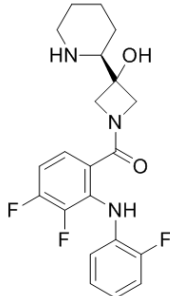
产品编号 : MB3615

质量标准 : >98%,高选择性 MEK1 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₁ F ₃ N ₃ O ₂	结 构 式	
分子量	531.31		
CAS No.	934660-93-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (188.21 mM) Water Insoluble Ethanol : 47 mg/mL warmed (88.46 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 : 考比替尼 Cobimetinib (GDC-0973, RG7420) 是有效, 选择性, 可口服的 MEK 抑制剂, 抑制 MEK1 的 IC₅₀ 为 4.2 nM。

别名 : GDC-0973; XL518 ; Cobimetinib ; Methanone,

[3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-iodophenyl)amino]phenyl][3-hydroxy-3-[(2S)-2-piperidinyl]-1-azetidiny]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (188.21 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 47 mg/mL warmed (88.46 mM)

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	Cobimetinib (GDC-0973, RG7420)是一种有效的高选择性 MEK1 抑制剂, IC ₅₀ 为 4.2 nM。其对 MEK1 的选择性比对 MEK2 高 100 倍以上, 对其他很多丝氨酸-苏氨酸和酪氨酸激酶没有显著抑制作用。	
靶点	MEK1 (Cell-free assay)	4.2 nM
体外研究	Cobimetinib 对一组广泛类型的肿瘤细胞的生长表现出强烈的抑制活性, 特别是对 BRAF 或 KRAS 突变型癌细胞系。结合 GDC-0941, GDC-0973 在 888MEL 和 A2058 细胞中导致生	

	存能力降低, 通路抑制, 以及细胞凋亡增加。GDC-0973 和 vemurafenib 联合给药显著增加所有 BRAFV600E 系中细胞膜上减少的 GLUT-1 水平。
体内研究	在负荷 BRAFV600E 和 KRAS 突变型肿瘤的小鼠体内, Cobimetinib (10 mg/kg, p.o.) 产生抗肿瘤作用, 结合 GDC-0973 和 GDC-0941 能够提高疗效。在负荷耐药的 A375 异种移植小鼠体内, GDC-0973 与 GDC-0941 结合诱导己糖激酶 II, c-RAF, Ksr 和 p-MEK 蛋白质的水平减少。

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)

MB4069	Binimetinib, ARRY-438162
MB5452	PD184352 (CI-1040)
MB4068	PD318088
MB4064	Pimasertib (AS-703026)

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。考比替尼 Cobimetinib (GDC-0973, RG7420) 是有效, 选择性, 可口服的 MEK 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8821 mL	9.4107 mL	18.8214 mL
5 mM	0.3764 mL	1.8821 mL	3.7643 mL
10 mM	0.1882 mL	0.9411 mL	1.8821 mL
50 mM	0.0376 mL	0.1882 mL	0.3764 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验:	Animal Models: 负荷 Molm-13, Molm-16, MX-1, DLD-1, HCT-116, LoVo, FaDu, 537MEL, A2058, A2058-X1, A375, A375.X1, A427, A549, Calu-6, EBC-1, NCI-H441, NCI-H2122, NCI-H460, NCI-H520.X1, SKOV-3, KP4-X1.1, MiaPaCa-2, 22Rv1, DU-145.X1, S, NCI-H69 异种移植瘤的小鼠 Formulation: -- Dosages: 10 mg/kg Administration: p.o.
--------------	---

【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。