

## AZD8330

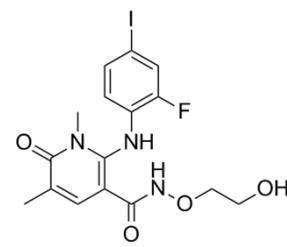
产品编号: MB4066

质量标准: >98%, MEK 1/2 抑制剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C16H17FIN3O4	结 构 式	
分子量	461.23		
CAS No.	869357-68-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 92 mg/mL (199.46 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 92 mg/mL (199.46 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:** AZD8330 是一种有效的非竞争性的 MEK1/MEK2 抑制剂。

**别名:** ARRY-424704; ARRY-704; 3-Pyridinecarboxamide,

2-[(2-fluoro-4-iodophenyl)amino]-1,6-dihydro-N-(2-hydroxyethoxy)-1,5-dimethyl-6-oxo

### 物理性状及指标:

外观: .....类白色至粉色固体

溶解性: .....DMSO: 92 mg/mL (199.46 mM); Water Insoluble; Ethanol : 92 mg/mL (199.46 mM)

含量: .....>98%

**储存条件:** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	AZD8330 是一种新型, 选择性的, 非 ATP 竞争性 MEK 1/2 抑制剂, IC50 为 7 nM。	
<b>特性</b>	AZD8330 是一种新型的有选择性高效率无竞争的针对 MEK 1/2 的抑制剂。	
<b>靶点</b>	ERK phosphorylation	MEK1/2
	0.4 nM	7 nM
<b>体外研究</b>	AZD8330 可以有效抑制 MEK 1/2。在 pERK 系统中 AZD8330 能达到超豪微摩尔级的效力, 在 MEK 1/2 抑制剂敏感的细胞系的功能 (扩增) 实验中也能达到低至超豪微摩尔级的效力。MEK 抑制剂 AZD8330 特异性抑制促分裂原活化蛋白激酶激酶 1 (MEK 或 MAP/ERK 激酶 1), 抑制了生长因子调节的细胞信号传导的过程并抑制了肿瘤细胞增殖。	
<b>体内研究</b>	在 Calu-6 大鼠异种移植药代动力学/药效 (PK/PD) 模型中, 单一使用 AZD8330 口服剂量 1.25 mg/kg, 4 到 8 小时就可以抑制 90% 以上的 ERK 磷酸化作用。在 Calu-6 裸鼠移植瘤模型中,	

每日一次药用剂量在 0.4 mg/kg 时就完全可以抑制 80%以上的肿瘤生长。在 Calu-6 模型中, AZD8330 抑制肿瘤生长是剂量依赖型的, 每天一次剂量在 0.3 mg/kg 和 1.0 mg/kg

**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)
MB9629	SL-327
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。AZD8330 是一种有效的非竞争性的 MEK1/MEK2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.1681 mL	10.8406 mL	21.6812 mL
5 mM		0.4336 mL	2.1681 mL	4.3362 mL
10 mM		0.2168 mL	1.0841 mL	2.1681 mL
50 mM		0.0434 mL	0.2168 mL	0.4336 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p>MEK1 酶活性分析: 用杆状病毒感染 Hi5 昆虫细胞表达, 然后利用固相金属亲和层析、离子交换、凝胶过滤的方法纯化出 NH2 末端六聚组氨酸标记的结构上有活性的 MEK1(S218D, S222D ΔR4F)。可以通过检测 MEK1 将 [γ- 33P]磷酸从 [γ-33P]ATP 连接到 ERK2 上的能力来评估 MEK1 的活性。首先将 25 mM HEPES(pH 7.4), 10 mM MgCl<sub>2</sub>, 5 mM β-磷酸甘油, 100 μM 钒酸钠, 5 mM DTT, 5 nM MEK1, 1 μM ERK2 和 0 到 80 nM 的 AZD8330 (终浓度 1% DMSO)混合置于在 96 孔聚丙烯板中, 加入 10 μM ATP (每孔 0.5 μC k[γ-33P]ATP) 起始反应, 室温孵育 45 分钟, 加入等体积 25%的三氯乙酸以终止反应并使蛋白沉淀。沉淀的蛋白与玻璃纤维 B 过滤板结合, 用 0.5%的磷酸将剩余的标记 ATP 洗掉, 然后用液体闪烁计数器统计反射性物质的含量。反应混合物种 ATP 数量的不同决定了反应的 ATP 依赖性。实验数据之后全部被拟合</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: Malme-3M 黑色素瘤细胞 Concentrations: 0 μM -10 μM Incubation Time: 1 小时 Method: 把 Malme-3M 黑色素瘤细胞接种到 96 孔板中, 在 37°C 条件下用不同浓度的 AZD8330 处理 1 小时。然后把细胞固定, 通透, 与磷酸化 ERK 抗体和 ERK 1/2 的抗体孵育。将细胞洗涤之后加入荧光二抗.然后将孔板用 LICOR 荧光成像系统读数. 把 pERK 的信号强度标准化为总的 ERK 信号强度.</p>
<b>动物实验</b>	<p>Animal Models: 携带 Calu-6 细胞的雌性裸鼠大鼠 (NIH rnu/rnu), 携带 SW620 细胞的裸鼠大鼠</p>

Formulation: 配制在 0.5% 羟丙基甲基纤维素, 加 0.1% Tween Dosages: 0.3 mg/kg, 1 mg/kg Administration: 口服
---

**【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。