

BIX 02188

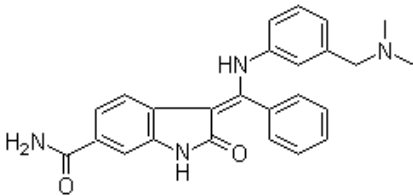
产品编号: MB4067

质量标准: >98%, MEK5 抑制剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C25H24N4O2	结 构 式	
分子量	412.48		
CAS No.	1094614-84-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 43 mg/mL (104.24 mM) Water Insoluble Ethanol : 3 mg/mL (7.27 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: BIX02188 是选择性 MEK5 抑制剂, 也抑制 ERK5 催化活性。

别名:

3-[[[3-[(Dimethylamino)methyl]phenyl]amino]phenylmethylene]-2,3-dihydro-2-oxo-1H-indole-6-carboxamide

物理性状及指标:

外观:白色至类白色粉末

溶解性:DMSO: 43 mg/mL (104.24 mM); Water Insoluble; Ethanol : 3 mg/mL (7.27 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	BIX02188 是选择性 MEK5 抑制剂, IC50 为 4.3 nM, 也抑制 ERK5 催化活性, IC50 为 810 nM, 且不抑制密切相关的激酶 MEK1, MEK2, ERK2, 和 JNK2。
靶点	MEK5
IC50	4.3 nM
体外研究	BIX02188 明显抑制 MEK5 催化活性, IC50 为 4.3 nM, 轻微抑制 ERK5 催化活性, IC50 为 0.83 μM, 作用于关系密切的激酶 MEK1, MEK2, ERK1, p38α, JNK2, TGFβ1, EGFR, 和 STK16 没有活性, 作用于 TGFβ1 时 IC50 为 1.8 μM, 作用于 p38α 时 IC50 为 3.9 μM, 作用于其他激酶 IC50 值都大于 6.3 μM。用 BIX02188 预处理 HeLa 细胞, 抑制山梨醇诱导的 ERK5 磷酸化, 这种作用存在剂量依赖性, 但是不会抑制 ERK1/2, p38, 和 JNK1/2 MAPKs 磷酸化。BIX02188 单独处理 HeLa 或 HEK293 细胞 24 小时, 没有毒性。

	BIX02188 作用于 HeLa 和 HEK293 细胞,通过在持续激活的 MEK5/ERK5/MEF2C 驱动的荧光素酶表达系统中的 MEK5/ERK5 信号级联反应抑制 MEF2C 转录激活, IC50 分别为 1.15 μ M 和 0.82 μ M。BIX02188 作用于 300 μ M H ₂ O ₂ 刺激的牛肺微血管内皮细胞 (BLMECs), 抑制 BMK1 磷酸化,这种作用存在剂量依赖性, IC50 为 0.8 μ M, 尤其通过抑制 MEK5 信号通路。
--	---

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)

MB1886	PD0325901
MB5132	PD98059
MB5401	Trametinib (GSK1120212)

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。BIX02188 是选择性 MEK5 抑制剂, 也抑制 ERK5 催化活性。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.4244 mL	12.1218 mL	24.2436 mL
5 mM		0.4849 mL	2.4244 mL	4.8487 mL
10 mM		0.2424 mL	1.2122 mL	2.4244 mL
50 mM		0.0485 mL	0.2424 mL	0.4849 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>催化实验: 使用 PKLight ATP 检测试剂, 及从杆状病毒表达系统中分离 MEK5 蛋白用于测定激酶活性。使用 15 nM GST-MEK5 和 0.75 μM ATP, 及含 25 mM HEPES, pH 7.5, 10 mM MgCl₂, 50 mM KCl, 0.2% BSA, 0.01% CHAPS, 100 μM Na₃VO₄, 0.5 mM DTT, 和 1% DMSO 的实验 buffer, 及有不同浓度 BIX02188 存在时进行反应。激酶反应混合物在室温下温育 90 分钟, 随后加入 10 μL ATP 检测试剂反应 15 分钟。测定相对光单位(RLU)信号, 然后转换 RLU 信号成对照组百分数(POC), 用于测定 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HeLa 细胞 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为 10 μM 左右 Incubation Time: 预处理 1.5 小时 Method: 细胞血清饥饿 20 小时, 然后用终浓度为 0.4 M 的山梨醇在 37°C 下刺激 20 分钟。加入山梨醇, 1.5 小时后, 加入 BIX02188。获得细胞, 溶于 50 μL 含 Hal 蛋白酶和磷酸抑制剂的 RIPA buffer 中, 在 4°C 下进行 5-10 分钟。溶解产物按 14,000 rpm 转速离心 10 分钟, 50 μL 溶解物加到 50 μL 2\times样本 buffer 中, 然后在 95°C 下进行 4 分钟 20 μL 样本在 SDS-PAGE 10% Tris-glycine gels 中跑胶, 然后转移到硝化纤维素上。使用合适抗体进行 Western blotting。</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。