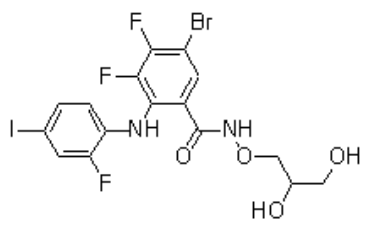


## PD318088

产品编号: MB4068  
质量标准: >98%, MEK1/2 变构抑制剂  
包装规格: 5MG;10MG;50MG  
产品形式: solid

### 基本信息

|           |                                 |             |   |
|-----------|---------------------------------|-------------|---|
| 分子式       | C16H13BrF3IN2O4                 | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量       | 561.09                          |             |   |
| CAS No.   | 391210-00-7                     |             |   |
| 储存条件      | -20°C, 避光防潮密闭干燥                 |             |   |
| 溶解性(25°C) | DMSO: 112 mg/mL (199.61 mM)     |             |   |
|           | Water Insoluble                 |             |   |
|           | Ethanol : 14 mg/mL (24.95 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:** PD318088 是一种变构 MEK 抑制剂。

**别名:** Benzamide,

5-bromo-N-(2,3-dihydroxypropoxy)-3,4-difluoro-2-[(2-fluoro-4-iodophenyl)amino]-

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

溶解性 .....DMSO: 112 mg/mL (199.61 mM); Water Insoluble; Ethanol : 14 mg/mL (24.95 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> | PD318088 是一种非 ATP 竞争性的, MEK1/2 变构抑制剂, 同时与 ATP 结合到 ATP 结合位点相邻的 MEK1 活性位点的区域中。  |
| <b>靶点</b>   | MEK1/2  |
| <b>体外研究</b> | PD318088 是小分子 MEK1/2 抑制剂, 是 PD184352 类似物。在 ATP 结合位点邻近的 MEK1 活性位点区域, PD318088 与 ATP 结合。PD318088 和 MgATP 复合物适当提高 MEK1 和 MEK2 单体-二聚体的 $K_d$ 。PD318088 和 MgATP 与 MEK1 结合也废除四聚体和更高聚合物的形成。PD318088 和 MgATP 一起促进 MEK1 和 MEK2 二聚物分离, 说明 PD318088 抑制机制可能是在活性位点局部构象变化的结果, 而不是全部结果的变化。 |

**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)       |

|        |                        |
|--------|------------------------|
| MB4064 | Pimasertib (AS-703026) |
| 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。PD318088 是一种变构 MEK 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

| 体 积<br>浓度 | 质 量       |           |            |
|-----------|-----------|-----------|------------|
|           | 1 mg      | 5 mg      | 10 mg      |
| 1 mM      | 1.7822 mL | 8.9112 mL | 17.8225 mL |
| 5 mM      | 0.3564 mL | 1.7822 mL | 3.5645 mL  |
| 10 mM     | 0.1782 mL | 0.8911 mL | 1.7822 mL  |
| 50 mM     | 0.0356 mL | 0.1782 mL | 0.3564 mL  |

#### 【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(M <sup>2</sup> ) | 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。