

MEK162; ARRY-162; Binimetinib; ARRY-438162

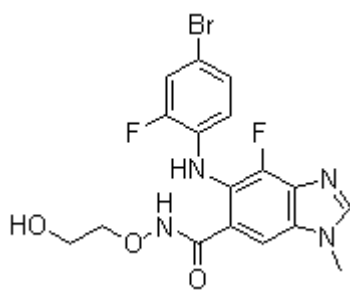
产品编号: MB4069

质量标准: >98%, 的 MEK1/2 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;100MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C17H15BrF2N4O3	结 构 式	
分子量	441.23		
CAS No.	606143-89-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 88 mg/mL warmed (199.44 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: MEK162 是口服和选择性的 MEK1/2 抑制剂。

别名: MEK162; ARRY-162; ARRY-438162; 1H-Benzimidazole-6-carboxamide, 5-[(4-bromo-2-fluorophenyl)amino]-4-fluoro-N-(2-hydroxyethoxy)-1-methyl

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 88 mg/mL warmed (199.44 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	MEK162 (ARRY-162, ARRY-438162)是有效的 MEK1/2 抑制剂, IC50 为 12 nM。
靶点	MEK
IC50	12 nM
体外研究	ARRY-438162(625 nM)抑制体外破骨细胞分化, IC50 为 39 nM。ARRY-438162(10 μM)抑制体外破骨细胞再吸收, IC50 为 625 nM。ARRY-438162(2 μM)微弱影响成骨细胞分化。ARRY-438162 是最近公开的一种有效的, 选择性, ATP 非竞争性的 MEK1/2 抑制剂, 作用于细胞, 抑制 pERK, IC50 为 11 nM。MEK162 (1 μM) 与 MK-2206 (2 μM)联用, 完全逆转表达 RSK 的 MCF7 细胞的抗性。
体内研究	ARRY-438162 按 10 mg/kg 剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎 (CIA) 和佐剂诱发性关节炎 (AIA) 模型, 每天两次, 降低疾病的严重程度, 这种作用具有剂量依赖性。ARRY-438162 按 1 mg/kg 和 3 mg/kg 剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎 (CIA) 模型, 每天两次, 抑制

<p>踝关节直径增加, 分别抑制 27%和 50%, 而 Ibuprofen 处理则抑制 46%。ARRY-438162 按 10 mg/kg 剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎 (CIA) 模型, 每天两次, 显著抑制病变 (炎症, 软骨损伤, 血管翳形成, 和骨重吸收), 按 1 mg/kg 和 3 mg/kg 剂量处理, 则分别抑制 32% 和 60%。ARRY-438162 按 3 mg/kg 和 10 mg/kg 剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎 (AIA) 模型, 抑制 AIA 踝关节直径, 分别抑制 11% 和 34%。ARRY-438162 按 10 mg/kg 和 30 mg/kg 剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎 (AIA) 模型, 与对照组相比, 显著抑制踝关节肿胀, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162 按 10 mg/kg 剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎 (AIA) 模型, 与对照组相比, 完全抑制血清中 IL-6 浓度, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162 按 30 mg/kg 剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎 (AIA) 模型, 与对照组相比, 抑制相对脾脏重量, 显著抑制骨重吸收和炎症, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162 (6 mg/kg, 每天两次) 与 BEZ235 联用, 处理注射 MCF7-RSK4 细胞的免疫缺陷小鼠, 显著降低肿瘤生长。</p>

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)

MB4068	PD318088
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。MEK162 是口服和选择性的 MEK1/2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.2664 mL	11.3320 mL	22.6639 mL
5 mM		0.4533 mL	2.2664 mL	4.5328 mL
10 mM		0.2266 mL	1.1332 mL	2.2664 mL
50 mM		0.0453 mL	0.2266 mL	0.4533 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	<p>Animal Models: 注射 MCF7-RSK4 细胞的免疫缺陷小鼠</p> <p>Formulation: 0.5% Tween-80, 1%羧甲基纤维素</p> <p>Dosages: 6 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</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。