

SB590885

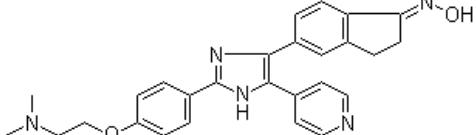
产品编号：MB4070

质量标准：>98%，B-Raf 抑制剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C27H27N5O2	结构式	
分子量	453.54		
CAS No.	405554-55-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 5 mg/mL (11.02 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：SB-590885 是一种有效的 B-Raf 抑制剂，其选择性是对 c-Raf 的 11 倍多。

别名：1H-Inden-1-one,

5-[2-[4-[2-(dimethylamino)ethoxy]phenyl]-5-(4-pyridinyl)-1H-imidazol-4-yl]-2,3-dihydro-, oxime

物理性状及指标：

外观：……………淡黄色至黄色固体

溶解性：…………DMSO: 5 mg/mL (11.02 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	SB590885 是一种有效的 B-Raf 抑制剂，无细胞试验中 K_i 为 0.16 nM，作用于 B-Raf 比作用于 c-Raf 选择性高 11 倍，对其他人类激酶没有抑制作用。
特性	对 B-Raf 表现出高于 c-Raf 的显著选择性
靶点	B-Raf (Cell-free assay) 0.16 nM(K_i)
体外研究	SB590885 对 B-Raf 比对 c-Raf 具有显著更高的选择性， K_i 分别为 0.16 nM 和 1.72 nM。SB-590885 是比之前描述的 Raf/VEGFR 激酶抑制剂 BAY 439006 (对突变型 B-Raf 和 c-Raf 的 K_i 分别为 38 nM 和 6 nM) 更有效的抑制剂。不同于多激酶抑制剂 BAY43-9006，SB590885 稳定致癌 B-Raf 激酶域的活性结构。在表达致癌 B-RafV600E 的 Colo205, HT29, A375P, SKMEL28, 和 MALME-3M 细胞中，SB590885 治疗有效抑制 ERK 磷酸化，EC50 分别为 28

	nM, 58 nM, 290 nM, 58 nM, 和 190 nM, 同样的, 抑制增殖的 EC50 分别为 0.1 μM, 0.87 μM, 0.37 μM, 0.12 μM, 和 0.15 μM。SB590885 以 BRAF 突变体选择性的方式减弱黑色素瘤细胞系的非贴壁依赖性生长。SB590885 对 B-Raf 表现出高亲和力, Kd 为 0.3 nM。大多数具有 BRAF V600E 突变体而缺乏 CDK4 突变体(451Lu, WM35, 和 WM983)的黑色素瘤细胞系对 SB590885 高度敏感, IC50 <1 μM。细胞周期素 D1 水平的增加是由于基因组扩增介导的 B-Raf V600E 突变型黑色素瘤对 SB590885 产生的抗药性。
体内研究	在负荷突变体 B-Raf 表达的 A375P 黑色素瘤细胞异种移植植物的小鼠体内, SB590885 给药有效降低肿瘤发生, 并适度抑制肿瘤生长。

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)

MB2102	Vemurafenib,PLX 4032
MB5133	PLX4720

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。SB-590885 是一种有效的 B-Raf 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

浓度 \ 体 积	质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.2049 mL	11.0244 mL	22.0488 mL
5 mM		0.4410 mL	2.2049 mL	4.4098 mL
10 mM		0.2205 mL	1.1024 mL	2.2049 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	Cell lines: Colo205, HT29, A375P, SKMEL28, 和 MALME-3M Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为~10 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 细胞用逐渐增加浓度的 SB590885 处理, 并培育 72 小时。活细胞使用 CellTiter-Glo 试剂和化学发光检测法在 Victor 2V 酶标仪上定量。在 Becton Dickinson FACScan 上制备细胞用于细胞周期分析。使用 CellQuest v3.3 软件获得数据并分析。
	Animal Models: 皮下注射 A375P 细胞的雌性裸鼠 Formulation: 在载体中[2% N,N-二甲基乙酰胺, 2%聚氧乙烯蓖麻油, 和 96%酸化水(pH f4-5)]溶解 Dosages: 50 mg/kg/day Administration: 腹腔注射

【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物变质；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 ²)	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



0411-62910999 www.meilune.com

大连博格林生物科技有限公司

Dalian Bergolin Biotechnology Co., Ltd

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。

Welcome
to **meilunbio**

本产品仅供科研使用。请勿用于医药、临床治疗、食品及化妆品用途。