

Dabrafenib ; GSK2118436A ; 达拉菲尼 ; 达帕菲尼

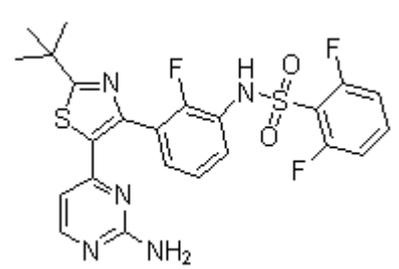
产品编号 : MB5000

质量标准 : >98%,BRAFV600 特异性抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₃ H ₂₀ F ₃ N ₅ O ₂ S ₂	结 构 式	
分子量	519.56		
CAS No.	1195765-45-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 30 mg/mL (57.74 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 : 达拉非尼 Dabrafenib 是 ATP 竞争型的 Raf 抑制剂, 抑制对象为 C-Raf 和 B-Raf^{V600E}。

别名 : GSK 2118436;达拉菲尼;GSK-2118436A;

n-(3-(5-(2-amino-4-pyrimidinyl)-2-(tert-butyl)-4-thiazolyl)-2-fluorophenyl)-2,6-difluorobenzenesulfonamide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 30 mg/mL (57.74 mM);WaterInsoluble;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	Dabrafenib (GSK2118436)是一种突变型 BRAFV600 特异性抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 0.8 nM, 作用于 B-Raf(wt)和 c-Raf 效果分别低 4 和 6 倍。		
靶点	B-Raf (V600E) (Cell-free assay)	B-Raf (Cell-free assay)	C-Raf (Cell-free assay)

	0.8 nM	3.2 nM	5.0 nM
体外研究	Dabrafenib 对 Raf 激酶具有选择性, 对 B-Raf 的活性比其它测试过的 91% 的激酶高 400 倍。Dabrafenib 抑制 B-Raf ^{V600E} 激酶, 导致 ERK 磷酸化降低和抑制细胞的增值, 在特异性编码突变的 B-Raf ^{V600E} 的癌细胞中细胞停滞在 G1 期。		
体内研究	Dabrafenib (口服) 抑制 B-Raf ^{V600E} 突变的黑色素瘤 (A375P) 的生长, 在免疫受损小鼠中皮下注射结肠癌 (Colo205), Dabrafenib (口服) 同样能抑制肿瘤生长。		

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)

MB4072	ZM 336372
MB3922	CEP-32496
MB4071	GW5074

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。本品达拉非尼 Dabrafenib 是 ATP 竞争型的 Raf 抑制剂, 抑制对象为 C-Raf 和 B-Raf^{V600E}。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	1.9247 mL	9.6235 mL	19.2471 mL
5 mM	0.3849 mL	1.9247 mL	3.8494 mL
10 mM	0.1925 mL	0.9624 mL	1.9247 mL
50 mM	0.0385 mL	0.1925 mL	0.3849 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。