

PD-98059 ; PD98059

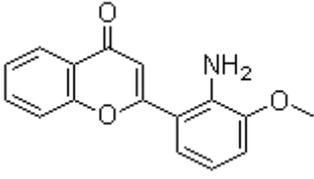
产品编号 : MB5132

质量标准 : >98% , MEK 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C16H13NO3	结 构 式	
分子量	267.28		
CAS No.	167869-21-8		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 14 mg/mL warmed (52.37 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 : PD98059 是有效, 选择性和可渗透细胞的 MEK1 和 MEK2 抑制剂。

别名 : 4H-1-Benzopyran-4-one, 2-(2-amino-3-methoxyphenyl)-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 14 mg/mL warmed (52.37 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	PD98059 是非 ATP 竞争性的 MEK 抑制剂, IC50 为 2 μM, 特异性抑制 MEK-1 调节的 MAPK 激活;不直接抑制 ERK1 或 ERK2。
靶点	MEK1
IC50	2 μM
体外研究	PD98059 要么抑制本底的 MEK1, 要么抑制一种被部分激活的 MEK 突变体, 该突变体是 218 和 222 号位上丝氨酸突变为谷氨酸后形成的(MEK-2E), IC50 为 2 μM.

	<p>PD98059 不会抑制 JNK 和 P38 这两个 MAPK 的同系物. PD98059 会高度选择性的抑制 MEK, 因为对其它包括 Raf 激酶, cAMP-依赖性激酶, 蛋白激酶 C, v-Src, 表皮生长因子 (EGF) 受体激酶, 胰岛素受体激酶, PDGF 受体激酶, 和磷脂酰肌醇(-3)激酶等在内的一系列激酶都没有抑制性. PD98059 会抑制经过 PDGF 刺激而活化的 MAPK 和胸苷进入 3T3 细胞, IC50 分别为 ~10 μM 和 ~7 μM. PD98059 可以有效地阻止 MEK1 被 Raf 或者 MEK 激酶活化, IC50 为 4 μM, 可以微弱地抑制 MEK2 被 Raf 活化, IC50 为 50 μM. 在 KB 和 PC12 细胞中, PD98059 不会抑制 MKK4 和 RK 激酶这两个参与压力和白细胞介素-1 介导的激酶级联反应的 MEK 的同系物的活化, 在 Swiss 3T3 细胞中也不会通过胰岛素或者表皮生长因子抑制 p70 S6 激酶的活化. PD98059 会在不改变细胞生存能力的情况下完全阻断神经生长因子(NGF)诱导的 PC12 细胞的分化. PD98059 会以剂量依赖性的方式抑制培养在含有破骨细胞分化因子培养基中的 RAW264.7 细胞的增值, 进而导致 TRAP 阳性细胞数量明显下降.</p>
体内研究	<p>在大脑缺血前 30 分钟用 PD98059 处理小鼠可以明显减轻伤害, 使脑梗塞的体积减小. 基于胰腺的湿重和组织学研究发现, 提前 30 分钟用 PD98059 预处理 (10 mg/kg 静脉注射) 然后每小时注射一次蛙皮素连续三次的小鼠可以明显改善蛙皮素诱导的急性胰腺炎. 卡拉胶损伤一小时后用 PD98059 (10 mg/kg) 对小鼠进行治疗可以发现与炎症相关的所有指标均有所下降.</p>
特征	<p>PD98059 不会抑制已经被 c-Raf 磷酸化的 MEK1</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)

MB1886	PD0325901
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. PD98059 是有效, 选择性和可渗透细胞的 MEK1 和 MEK2 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		3.7414 mL	18.7070 mL	37.4139 mL
5 mM		0.7483 mL	3.7414 mL	7.4828 mL
10 mM		0.3741 mL	1.8707 mL	3.7414 mL
50 mM		0.0748 mL	0.3741 mL	0.7483 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>体外 MEK 激酶活性测定: 在含有 44-kDa GST-MAPK 或者 45-kDa GST-MEK1 的体系中检测 ³²P 被掺入蛋白 MBP 中的情况。反应体系 50 μL , 含有 50 mM Tris, pH 7.4/10 mM MgCl₂/2 mM EGTA/10 μM [γ-³²P]ATP , 加入 10 μg GST-MEK1, 0.5 μg GST-MAPK 和 40 μg MBP。30°C 孵育 15 分钟, 加入 Laemmli SDS 样品缓冲液终止反应。磷酸化的 MBP 进行 10% SDS-PAGE 分析</p>
细胞实验	<p>Cell lines: K-Balb, KNRK, v-raf-3Y1, SRA/3Y1, EGFR/3T3, 和 K562 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度~100 μM Incubation Time: 3 天, 或者 7-10 天 Method: 细胞按 10,000-20,000 个/mL 的密度接种在多孔平板中进行单层生长。48 小时后把不同浓度的 PD98059 加到细胞培养基孵育 3 天。然后通过胰酶将细胞从平板中消化下来并用 Coulter 计数器计数。将细胞按 5,000-10,000 每皿的浓度接种在 35 mm 的培养皿中, 培养基中含有 0.3% 的琼脂和期望浓度的 PD98059, 让细胞在软琼脂上生长经过 7-10 天的生长, 可以借助解剖显微镜将可见的菌落数出来。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 患有急性胰腺炎的雄性 Sprague–Dawley 大鼠 Formulation: 溶于 DMSO, 用生理盐水稀释 Dosages: 10 mg/kg Administration: 静脉注射</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, 否则会严重影响化合物活性, 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。