

GDC-0994 ; GDC0994

产品编号：MB5899

质量标准：ERK1/2 抑制剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C21H18ClFN6O2	结 构 式	
分子量	440.86		
CAS No.	1453848-26-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 87 mg/mL (197.79 mM) Water Insoluble Ethanol 87 mg/mL (197.79 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： Ravoxertinib (GDC-0994) 是可口服的 ERK 激酶抑制剂。

别名： 2(1H)-Pyridinone,

1-[(1S)-1-(4-chloro-3-fluorophenyl)-2-hydroxyethyl]-4-[2-[(1-methyl-1H-pyrazol-5-yl)amino]-4-pyrimidinyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色固体

溶解性：.....DMSO 87 mg/mL (197.79 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 87 mg/mL (197.79 mM)

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	GDC-0994 是一种有效的，可口服的，具有选择性的 ERK1/2 抑制剂，其 IC50 分别为 1.1 nM 和 0.3 nM。 Phase 1。					
靶点	<table border="1"> <tr> <td>ERK2 (Cell-free assay)</td> <td>ERK1 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>0.3 nM</td> <td>1.1 nM</td> </tr> </table>	ERK2 (Cell-free assay)	ERK1 (Cell-free assay)	0.3 nM	1.1 nM	
ERK2 (Cell-free assay)	ERK1 (Cell-free assay)					
0.3 nM	1.1 nM					
体外研究	GDC-0994 有效抑制肿瘤细胞中磷酸-p90RSK。					
体内研究	GDC-0994(口服)在体外癌症模型中引起显著的多重单剂量活性，包括 KRAS 突变型和 BRAF 突变型人异种移植肿瘤的小鼠。在体内，GDC-0994 (口服)抑制 ERK 磷酸化和 ERK 介导的信号转导通路的激活，随后防止 ERK 依赖性肿瘤细胞增殖和存活。					

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)

MB4560	GSK2656157
--------	------------

MB4567	ISRIB(trans-isomer)
MB3432	SCH772984

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。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2735 mL	11.3675 mL	22.7350 mL
5 mM	0.4547 mL	2.2735 mL	4.5470 mL
10 mM	0.2274 mL	1.1368 mL	2.2735 mL
50 mM	0.0455 mL	0.2274 mL	0.4547 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(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。