

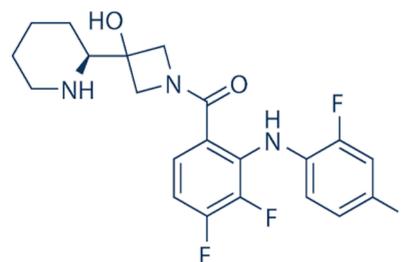
## Cobimetinib (MEK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD5942-10mM	Cobimetinib (MEK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5942-5mg	Cobimetinib (MEK抑制剂)	5mg
SD5942-25mg	Cobimetinib (MEK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	[3,4-difluoro-2-(2-fluoro-4-iodoanilino)phenyl]-[3-hydroxy-3-[(2S)-piperidin-2-yl]azetidin-1-yl]methanone
简称	Cobimetinib
别名	GDC-0973, RG7420, XL518, GDC 0973, GDC0973, XL518, XL-518
中文名	N/A
化学式	C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> IN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>
分子量	531.31
CAS号	934660-93-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 47mg/ml warming
溶液配制	5mg加入0.94ml DMSO, 或每5.31mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD5942-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Cobimetinib (GDC-0973, RG7420)是一种有效的高选择性MEK1抑制剂, IC50为4.2nM。Phase 3。				
信号通路	MAPK				
靶点	MEK1	—	—	—	—
IC50	4.2nM	—	—	—	—
体外研究	Cobimetinib对一组广泛类型的肿瘤细胞的生长表现出强烈的抑制活性, 特别是对BRAF或KRAS突变型癌细胞系。结合GDC-0941, GDC-0973在888MEL和A2058细胞中导致生存能力降低, 通路抑制, 以及细胞凋亡增加。GDC-0973和vemurafenib联合给药显著增加所有BRAFV600E系中细胞膜上减少的GLUT-1水平。				
体内研究	在负荷BRAFV600E和KRAS突变型肿瘤的小鼠体内, Cobimetinib (10mg/kg, p.o.)产生抗肿瘤作用, 结合GDC-0973和GDC-0941能够提高疗效。在负荷耐药的A375异种移植小鼠体内, GDC-0973与GDC-0941结合诱导已糖激酶II, c-RAF、Ksr和p-MEK蛋白质的水平减少。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	Human 888MEL (BRAFV600E) mutant melanoma cell lines
浓度	~10μM
处理时间	4 days
方法	Cells are plated in quadruplicate at a density of 3,000 per well in 384-well plates in normal growth medium and allowed to adhere overnight. Compounds are added in 10 concentrations based on a 3-fold dilution series. Cell viability is measured 72h later using the CellTiter-Glo Luminescent Cell Viability Assay.

动物实验	
动物模型	负荷Molm-13, Molm-16, MX-1, DLD-1, HCT-116, LoVo, FaDu, 537MEL, A2058, A2058-X1, A375, A375.X1, A427, A549, Calu-6, EBC-1, NCI-H441, NCI-H2122, NCI-H460, NCI-H520.X1, SKOV-3, KP4-X1.1, MiaPaCa-2, 22Rv1, DU-145.X1, S, NCI-H69异种移植瘤的小鼠
配制	N/A
剂量	10mg/kg
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

- 1.Hoeflich KP, et al. Cancer Res. 2012, 72(1), 210-219.
- 2.Baudy AR, et al. EJNMMI Res. 2012, 2(1), 22.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD5942-10mM	Cobimetinib (MEK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5942-5mg	Cobimetinib (MEK抑制剂)	5mg
SD5942-25mg	Cobimetinib (MEK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01