



碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology
订货热线: 400-168-3301或800-8283301
订货e-mail: order@beyotime.com
技术咨询: info@beyotime.com
网址: http://www.beyotime.com

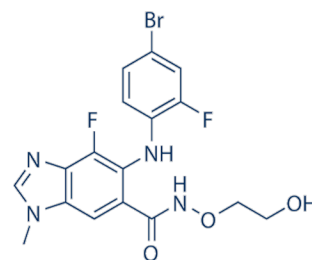
Binimetinib (MEK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD5951-10mM	Binimetinib (MEK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5951-5mg	Binimetinib (MEK抑制剂)	5mg
SD5951-25mg	Binimetinib (MEK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-(4-bromo-2-fluoroanilino)-7-fluoro-N-(2-hydroxyethoxy)-3-methylbenzimidazole-5-carboxamide
简称	Binimetinib
别名	MEK162, MEK-162, MEK 162, ARRY-162, ARRY 162, ARRY162, ARRY-438162, ARRY 438162, ARRY438162
中文名	N/A
化学式	C ₁₇ H ₁₅ BrF ₂ N ₄ O ₃
分子量	441.23
CAS号	606143-89-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 88mg/m warmingl; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.13ml DMSO, 或每4.41mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD5951-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Binimetinib (MEK162, ARRY-162, ARRY-438162)是一种有效的MEK1/2抑制剂, 无细胞试验中IC50为12nM。Phase 3。				
信号通路	MAPK				
靶点	MEK	—	—	—	—
IC50	12nM	—	—	—	—
体外研究	ARRY-438162(625nM)抑制体外破骨细胞分化, IC50为39nM。ARRY-438162(10μM)抑制体外破骨细胞再吸收, IC50为625nM。ARRY-438162(2μM)微弱影响成骨细胞分化。ARRY-438162是最近公开的一种有效的, 选择性, ATP非竞争性的MEK1/2抑制剂, 作用于细胞, 抑制pERK, IC50为11nM。MEK162(1μM)与MK-2206(2μM)联用, 完全逆转表达RSK的MCF7细胞的抗性。				
体内研究	ARRY-438162按10mg/kg剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎(CIA)和佐剂诱发性关节炎(AIA)模型, 每天两次, 降低疾病的严重程度, 这种作用具有剂量依赖性。ARRY-438162按1mg/kg和3mg/kg剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎(CIA)模型, 每天两次, 抑制踝关节直径增加, 分别抑制27%和50%, 而Ibuprofen处理则抑制46%。ARRY-438162按10mg/kg剂量口服处理大鼠胶原诱导性关节炎(CIA)模型, 每天两次, 显著抑制病变(炎症, 软骨损伤, 血管翳形成和骨重吸收), 按1mg/kg和3mg/kg剂量处理, 则分别抑制32%和60%。ARRY-438162按3mg/kg和10mg/kg剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎(AIA)模型, 抑制AIA踝关节直径, 分别抑制11%和34%。ARRY-438162按10mg/kg和30mg/kg剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎(AIA)模型, 与对照组相比, 显著抑制踝关节肿胀, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162按10mg/kg剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎(AIA)模型, 与对照组相比, 完全抑制血清中IL-6浓度, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162按30mg/kg剂量处理大鼠佐剂诱发性关节炎(AIA)模型, 与对照组相比, 抑制相对脾脏重量, 显著抑制骨重吸收和炎症, 这种作用具有剂量相关性。ARRY-438162(6mg/kg, 每天两次)与BEZ235联用, 处理注射MCF7-RSK4细胞的免疫缺陷小鼠, 显著降低肿瘤生长。				
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	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	注射MCF7-RSK4细胞的免疫缺陷小鼠
配制	0.5% Tween-80, 1%羧甲基纤维素
剂量	6mg/kg
给药方式	口服处理

➤ 参考文献:

- 1.SS Bhagwat, et al. Annu Rep Med Chem, 2007, 42, 265-278.
- 2.Serra V, et al. J Clin Invest, 2013, 123(6), 2551-2563.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD5951-10mM	Binimetinib (MEK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5951-5mg	Binimetinib (MEK抑制剂)	5mg
SD5951-25mg	Binimetinib (MEK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20℃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℃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