

SB-590885

产品信息

产品名称	产品编号	规格
SB-590885	53596ES08	5 mg
	53596ES25	25 mg

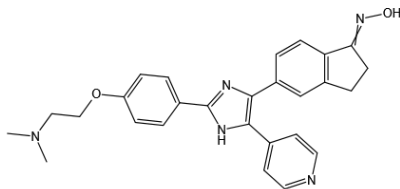
产品描述

SB-590885 (SB590885) 是 ATP 竞争性的 B-Raf 选择性抑制剂, K_i 值为 0.16 nM, 具有潜在抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	SB-590885, SB590885
靶点 (Target)	B-Raf/c-Raf
通路 (Pathway)	MAPK/ERK--Raf
CAS 号 (CAS NO.)	405554-55-4
分子式 (Formula)	$C_{27}H_{27}N_5O_2$
分子量 (Molecular Weight)	453.54
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C , 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

在表达 B-RafV600E 的 Colo205、HT29、A375P、SKMEL28 和 MALME-3M 细胞中, SB-590885 有效抑制 ERK 磷酸化, EC_{50} 分别为 28 nM、58 nM、290 nM、58 nM 和 190 nM, 并且抑制增殖, EC_{50} 分别为 0.1 μM 、0.87 μM 、0.37 μM 、0.12 μM

和 $0.15\ \mu\text{M}$ 。^[1] SB-590885 对 B-Raf 显示出高亲和力, K_d 为 $0.3\ \text{nM}$ 。^[2] 大多数具有 BRAF V600E 突变且缺乏 CDK4 突变 (451Lu、WM35 和 WM983) 的黑素瘤细胞系对 SB-590885 高度敏感, $\text{IC}_{50} < 1\ \mu\text{M}$ 。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在表达 B-Raf 突变的 A375P 移植瘤小鼠模型中, 给药 SB-590885 (50 mg/kg) 抑制瘤体生长。^[1]

参考文献

- [1]. King AJ, et al. Demonstration of a genetic therapeutic index for tumors expressing oncogenic BRAF by the kinase inhibitor SB-590885. *Cancer Res*, 2006, 66(23), 11100-11105.
- [2]. Takle AK, et al. The identification of potent and selective imidazole-based inhibitors of B-Raf kinase. *Bioorg Med Chem Lett*, 2006, 16(2), 378-381.
- [3]. Smalley KS, et al. Increased cyclin D1 expression can mediate BRAF inhibitor resistance in BRAF V600E-mutated melanomas. *Mol Cancer Ther*, 2008, 7(9), 2876-2883.