



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Pexmetinib (ARRY-614)**

CAS 号: **945614-12-0**

产品货号: **S88232**

生物活性:

Description	Pexmetinib 是一种有效的 Tie-2 和 p38 MAPK 双重抑制剂, 对 Tie-2, p38 α 和 p38 β 的 IC50 值分别为 1 nM, 35 nM 和 26 nM, 可用于急性骨髓性白血病的研究。				
IC50 & Target	IC50: 1 nM (Tie-2), 35 nM (p38 α), 26 nM (p38 β) [1]				
In Vitro	Pexmetinib 是一种 Tie-2 和 p38 MAPK 双重抑制剂, 对 Tie-2、p38 α 和 p38 β 的 IC50 分别为 1 nM、35 nM 和 26 nM。此外, Pexmetinib 对 Abl、Arg、FGFR1、Flt1、Flt4、Fyn、Hck、Lyn 和 MINK 的 IC50 分别为 4 nM、10 nM、28 nM、47 nM、42 nM、41 nM、26 nM、25 nM 和 26 nM。 Pexmetinib (0.5; 1 μ M) 在骨髓增生异常综合征中阻止白血病细胞增殖并刺激造血活性[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (224.57 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
	Preparing	1 mM	1.7965 mL	8.9826 mL	17.9653 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3593 mL	1.7965 mL	3.5931 mL
		10 mM	0.1797 mL	0.8983 mL	1.7965 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (3.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Bachegowda L, et al. Pexmetinib: A Novel Dual Inhibitor of Tie2 and p38 MAPK with Efficacy in Preclinical Models of Myelodysplastic Syndromes and Acute Myeloid Leukemia. Cancer Res. 2016 Aug 15;76(16):4841-4849.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。 -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.7965 mL	8.9826 mL	17.9653 mL	44.9131 mL
	5 mM	0.3593 mL	1.7965 mL	3.5931 mL	8.9826 mL
	10 mM	0.1797 mL	0.8983 mL	1.7965 mL	4.4913 mL
	15 mM	0.1198 mL	0.5988 mL	1.1977 mL	2.9942 mL
	20 mM	0.0898 mL	0.4491 mL	0.8983 mL	2.2457 mL
	25 mM	0.0719 mL	0.3593 mL	0.7186 mL	1.7965 mL
	30 mM	0.0599 mL	0.2994 mL	0.5988 mL	1.4971 mL
	40 mM	0.0449 mL	0.2246 mL	0.4491 mL	1.1228 mL
	50 mM	0.0359 mL	0.1797 mL	0.3593 mL	0.8983 mL
	60 mM	0.0299 mL	0.1497 mL	0.2994 mL	0.7486 mL
	80 mM	0.0225 mL	0.1123 mL	0.2246 mL	0.5614 mL
	100 mM	0.0180 mL	0.0898 mL	0.1797 mL	0.4491 mL