



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

产品名称: **PLX8394**
CAS 号: **1393466-87-9**
产品货号: **S88843**

生物活性:

Description	PLX8394 是一种有效的, 选择性的 BRAf 抑制剂, 抑制 BRAFV600E 活性的 IC50 值约为 5 nM。				
IC50 & Target[1]	BRAf ^{V600E} 5 nM (IC ₅₀)				
In Vitro	PLX8394 在 PRT #3 和 PRT #4 细胞中以 >25 nM 以及在 10 nM 时有效抑制亲本细胞中的 ERK1/2 磷酸化。PLX8394 有效降低细胞周期蛋白 D3 和细胞周期蛋白 D1、视网膜母细胞瘤蛋白的磷酸化以及亲代细胞和 PRT #3 和 PRT #4 细胞中细胞周期蛋白 A2 的表达。PLX8394 抑制 ERK1/2 磷酸化和携带 BRAF V600K/L505H 双突变或转座子诱导的 N 末端截短形式的 BRAF PLX4032 抗性细胞的生长[1]。PLX8394 显著损害肿瘤细胞生长并抑制表达内源性 V600E 或非 V600 突变形式 BRAF[2]的 LA 细胞系中的 MAPK 信号传导。				
In Vivo	PLX8394 (150 mg/kg/d) 显著抑制这些 H1755 异种移植肿瘤中的肿瘤生长、MAPK 通路信号和肿瘤细胞增殖, 对小鼠没有明显毒性。PLX8394 与 CP-358774 结合产生 >1 μM 的 CP-358774 血浆浓度[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (230.40 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
	Preparing	1 mM	1.8432 mL	9.2161 mL	18.4322 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3686 mL	1.8432 mL	3.6864 mL
		10 mM	0.1843 mL	0.9216 mL	1.8432 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 5 mg/mL (9.22 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 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 50.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均					



	匀。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.83 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。
参考文献	[1]. Basile KJ, et al. Inhibition of mutant BRAF splice variant signaling by next-generation, selective RAF inhibitors. Pigment Cell Melanoma Res. 2014 May;27(3):479-484. [2]. Okimoto RA, et al. Preclinical efficacy of a RAF inhibitor that evades paradoxical MAPK pathway activation in protein kinase BRAF-mutant lung cancer. Proc Natl Acad Sci U S A. 2016 Nov 22;113(47):13456-13461.

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° 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8432 mL	9.2161 mL	18.4322 mL	46.0804 mL
	5 mM	0.3686 mL	1.8432 mL	3.6864 mL	9.2161 mL
	10 mM	0.1843 mL	0.9216 mL	1.8432 mL	4.6080 mL
	15 mM	0.1229 mL	0.6144 mL	1.2288 mL	3.0720 mL
	20 mM	0.0922 mL	0.4608 mL	0.9216 mL	2.3040 mL
	25 mM	0.0737 mL	0.3686 mL	0.7373 mL	1.8432 mL
	30 mM	0.0614 mL	0.3072 mL	0.6144 mL	1.5360 mL
	40 mM	0.0461 mL	0.2304 mL	0.4608 mL	1.1520 mL
	50 mM	0.0369 mL	0.1843 mL	0.3686 mL	0.9216 mL
	60 mM	0.0307 mL	0.1536 mL	0.3072 mL	0.7680 mL
	80 mM	0.0230 mL	0.1152 mL	0.2304 mL	0.5760 mL
	100 mM	0.0184 mL	0.0922 mL	0.1843 mL	0.4608 mL