

## Pimasertib

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Pimasertib	53806ES10	10 mg
	53806ES50	50 mg

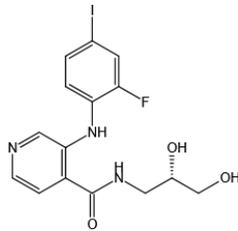
### 产品描述

Pimasertib (AS703026, MSC1936369B, AS-703026, MSC-1936369B)是可口服的、ATP 非竞争性的 MEK1/2 变构抑制剂, 具有抗癌活性。MEK/ERK 通路在细胞存活、增殖和分化种有重要作用, 在癌症中活性经常被上调。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Pimasertib, AS703026, MSC1936369B, AS-703026, MSC-1936369B
靶点 (Target)	MEK1/2
通路 (Pathway)	MAPK/ERK--MEK
CAS 号 (CAS NO.)	1236699-92-5
分子式 (Formula)	C <sub>15</sub> H <sub>15</sub> FIN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>
分子量 (Molecular Weight)	431.20
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥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℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃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)

在人多发性骨髓瘤细胞中，AS703026 (0.1-5  $\mu$ M)抑制 ERK1/2 的激活，并以剂量依赖方式抑制细胞生长。<sup>[1]</sup> 在西妥昔单抗耐药 D-MUT 细胞中，AS703026 (10  $\mu$ M)抑制 ERK 通路和细胞增殖。<sup>[2]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

在 H929 MM 移植瘤小鼠模型中，口服 AS703026 (15 or 30 mg/kg)显著抑制肿瘤生长。<sup>[1]</sup> 在 K-Ras 突变的 D-MUT 细胞移植瘤小鼠模型中，口服 AS703026 (10 mg/kg)显著抑制肿瘤生长，且明显降低 p-ERK 水平。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1] Kim K, et al. Blockade of the MEK/ERK signalling cascade by AS703026, a novel selective MEK1/2 inhibitor, induces pleiotropic anti-myeloma activity in vitro and in vivo. *Free Br J Haematol.* 2010 May;149(4):537-49.
- [2] Park SJ, et al. The MEK1/2 inhibitor AS703026 circumvents resistance to the BRAF inhibitor PLX4032 in human malignant melanoma cells. *Am J Med Sci.* 2013 Dec;346(6):494-8.
- [3] Yoon J, et al. MEK1/2 inhibitors AS703026 and AZD6244 may be potential therapies for KRAS mutated colorectal cancer that is resistant to EGFR monoclonal antibody therapy. *Cancer Res.* 2011 Jan 15;71(2):445-53.