

Cobimetinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Cobimetinib	53814ES08	5 mg
	53814ES25	25 mg

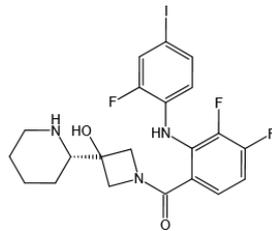
产品描述

Cobimetinib (GDC-0973, XL518, RG7420, GDC0973, XL-518, RG-7420), 又称考比替尼、克吡替尼、卡吡替尼或可美替尼, 是可口服的 MEK1 抑制剂, IC_{50} 为 4.2 nM, 通过抑制 MEK1/2 下游信号传导来诱导细胞凋亡, 具有抗癌活性, 临床上用于治疗 BRAF V600E 或 V600K 突变的黑色素瘤患者。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Cobimetinib, GDC-0973, XL518, RG7420, GDC0973, XL-518, RG-7420
中文名称 (Chinese Name)	考比替尼, 克吡替尼, 卡吡替尼, 可美替尼
靶点 (Target)	MEK1
通路 (Pathway)	MAPK/ERK--MEK
CAS 号 (CAS NO.)	934660-93-2
分子式 (Formula)	$C_{21}H_{21}F_3IN_3O_2$
分子量 (Molecular Weight)	531.31
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 $-20^{\circ}C$, 有效期 3 年。建议分装后 $-20^{\circ}C$ 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 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）

Cobimetinib 作用于 888MEL 和 A2058 细胞的 EC_{50} 为 $0.2 \mu\text{M}$ 和 $10 \mu\text{M}$ 。^[1] 在 A375 细胞中，Cobimetinib (100 nM) 诱导细胞死亡。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

在 NCI-H2122 (KRAS^{G12C}) 移植瘤小鼠模型中，给药 Cobimetinib (5 mg/kg) 抑制瘤体生长，导致中度 TGI，当给药至 10 mg/kg 时完全抑制肿瘤生长。^[1]

参考文献

- [1] Hoeflich KP, et al. Intermittent administration of MEK inhibitor GDC-0973 plus PI3K inhibitor GDC-0941 triggers robust apoptosis and tumor growth inhibition. *Cancer Res.* 2012 Jan 1;72(1):210-9.
- [2] Choo EF, et al. PK-PD modeling of combination efficacy effect from administration of the MEK inhibitor GDC-0973 and PI3K inhibitor GDC-0941 in A2058 xenografts. *Cancer Chemother Pharmacol.* 2013 Jan;71(1):133-43.
- [3] Corazao-Rozas P, et al. Mitochondrial oxidative phosphorylation controls cancer cell's life and death decisions upon exposure to MAPK inhibitors. *Oncotarget.* 2016 Jun 28;7(26):39473-39485.