

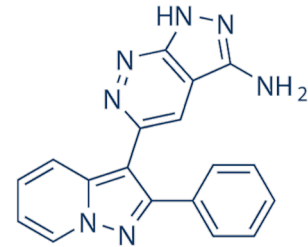
FR 180204 (ERK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD5978-10mM	FR 180204 (ERK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5978-5mg	FR 180204 (ERK抑制剂)	5mg
SD5978-25mg	FR 180204 (ERK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-(2-phenylpyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridazin-3-amine
简称	FR 180204
别名	FR-180204, FR180204
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₁₃ N ₇
分子量	327.34
CAS号	865362-74-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 65mg/ml; Ethanol 2mg/ml warming
溶液配制	5mg加入1.53ml DMSO, 或每3.27mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD5978-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	FR 180204是一种ATP-竞争性的选择性的ERK抑制剂, 其作用于ERK1和ERK2的Ki分别为0.31μM和0.14μM。				
信号通路	MAPK				
靶点	ERK2	ERK1	—	—	—
IC50	0.14μM(Ki)	0.31μM(Ki)	—	—	—
体外研究	在AP-1转染的细胞中, FR 180204剂量依赖性抑制AP-1反式激活, IC50为3.1μM。FR 180204抑制自发性间皮瘤细胞生长。				
体内研究	在胶原诱导性关节炎的小鼠体内, FR180204(100毫克/千克, 腹腔注射, b.i.d.)显著减少症状恶化和体重损失。在注射登革病毒(DENV)的小鼠模型中, FR180204限制肝细胞凋亡, 减少DENV诱导的肝脏损伤, 并提高临床指标。				
临床实验	N/A				
特征	ERK1/ERK2-选择性抑制剂。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	Nunc-Immuno MaxiSorp板在磷酸缓冲盐水(PBS)中用20微克/毫升MBP溶液涂覆。用包含0.05% Tween 20(T-PBS)的PBS洗涤后, 每孔中加入封闭缓冲液(包含3% BSA的T-PBS), 板在室温下培育10分钟。用T-PBS洗涤后, 在测试缓冲液(20mM Mops, pH 7.2, 25mM β-甘油磷酸盐, 5mM EGTA, 1mM 原钒酸钠, 1mM二硫苏糖醇和50微克/毫升BSA)中稀释的化学化合物, ATP和重组ERK2加入到每个孔中。载体组(包含0.1% DMSO)和除去激酶组作为对照和基础测定。在室温下培育1小时后, 板用T-PBS洗涤两次。抗-磷酸MBP抗体(0.2微克/毫升)加入到每孔中, 将板在室温下培育1小时。洗涤后, 加入抗-小鼠HRP共轭的多克隆抗体, 将板再培育30分钟。SuperSignal化学发光底物根据制造商的说明用于HRP活性的测定。Prism 4.0软件用于Lineweaver-Burk图的分析, IC50和Ki的测定。

细胞实验	
细胞系	Met5A, MSTO-211H, NCI-H28, NCI-H2052和NCIH2452细胞系
浓度	10μM

处理时间	48小时
方法	细胞活性使用MTT法测定。MTT活性细胞在570nm吸光度下使用微板阅读器量化。

动物实验	
动物模型	胶原诱导性关节炎小鼠模型
配制	悬浮在0.1%甲基纤维素溶液中
剂量	100毫克/千克
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Ohori M, et al. Biochem Biophys Res Commun. 2005, 336(1), 357-363.
- 2.Ohori M, et al. Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol. 2007, 374(4), 311-316.
- 3.Honda M, et al. Cell Physiol Biochem. 2012, 29(5-6), 667-674.
- 4.Sreekanth GP, et al. Virus Res. 2014, 188, 15-26.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD5978-10mM	FR 180204 (ERK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5978-5mg	FR 180204 (ERK抑制剂)	5mg
SD5978-25mg	FR 180204 (ERK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01