

SCH772984

产品信息

产品名称	产品编号	规格
SCH772984	53034ES08	5 mg
	53034ES10	10 mg
	53034ES50	50 mg

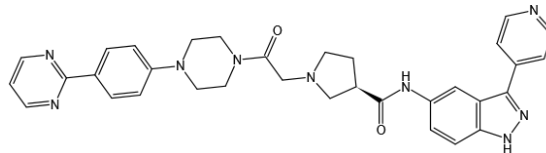
产品描述

SCH772984 (SCH-772984)是一种新型高选择性、ATP 竞争性的 ERK1/2 抑制剂, IC₅₀ 分别为 4 nM 和 1 nM, 强烈抑制含有 RAS 或 BRAF 突变的癌细胞的生长。此外, SCH772984 对 7 种激酶 (MAP4K4、MAPK1、CLK2、GSG2、FLT4、MINK1、PRKD1 和 TTK) 具有高选择性, 在 1 μM 浓度时抑制超过 50%的活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	SCH-772984, SCH772984
靶点 (Target)	ERK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	942183-80-4
分子式 (Formula)	C ₃₃ H ₃₃ N ₉ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	587.67
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°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C避光保存, 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)

SCH772984 抑制约 88%和 49%BRAF 突变型或 RAS 突变型肿瘤细胞系, EC₅₀ 值<500 nM。用 SCH772984 处理 SCH772984

敏感性黑色素瘤细胞。导致细胞 G1 期阻滞、凋亡增加。SCH772984 有效抑制 PLX4032 耐药的 BRAF 突变黑色素瘤细胞系和 GSK1120212 耐药的 KRAS 突变的结直肠癌细胞系的增殖。^[1] 在 BRAF 野生型黑色素瘤细胞系中, 用 500 nM SCH772984 处理 SCH772984 敏感的 M408 细胞, pRSK 和 pERK1/2 减少, pMEK 轻微增加, 总 RSK、MEK、ERK 1/2 或 AKT 表达没有变化。500 nM SCH772984 处理 SCH772984 耐药 M202 细胞, pMEK 适度诱导, pERK 和 pRSK 降低。^[2]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 human LOX BRAF-mutant 黑色素瘤异种移植模型中, 口服 50 mg/kg SCH772984, 导致 98% 的肿瘤消退。在 KRAS 突变的 MiaPaCa 胰腺癌异种移植模型中, 口服 50 mg/kg SCH772984, 肿瘤消退 36%, 并且肿瘤组织中 ERK 磷酸化也被显著抑制。^[1] 在人胰腺癌异种移植模型中, 联用 Dinaciclib (20 mg/kg, i.p., t.i.w.) 和 SCH772984 (25 mg/kg, i.p., b.i.d.) 显著抑制原位瘤的生长, 转移性病变的数目也下降。^[3]

参考文献

- [1]. Morris EJ, et al. Discovery of a novel ERK inhibitor with activity in models of acquired resistance to BRAF and MEK inhibitors. *Cancer Discov.* 2013;3(7):742-50.
- [2]. Wong DJL, et al. Antitumor activity of the ERK inhibitor SCH722984 against BRAF mutant, NRAS mutant and wild-type melanoma. *Molecular cancer*, 2014;13(1): 194.
- [3]. Hu C, et al. Combined inhibition of cyclin-dependent kinases (Dinaciclib) and AKT (MK-2206) or ERK (SCH772984) dramatically blocks pancreatic tumor growth and metastases in patient-derived orthotopic xenograft models. *Mol Cancer Ther.* 2015;14(7):1532-9.