

HB181214

U0126

产品信息

产品名称	产品编号	规格
U0126	52004ES08	5 mg
U0126	52004ES25	25 mg
U0126	52004ES50	50 mg
U0126	52004ES60	100 mg
U0126	52004ES76	500 mg

产品描述

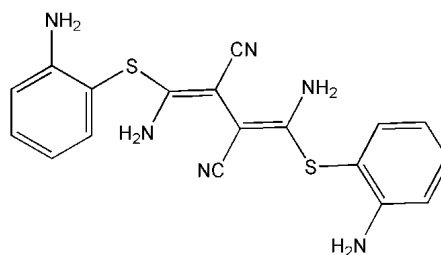
U0126 是一种选择性、非竞争性 MAPK 激酶抑制剂，作用于 MEK1 和 MEK2，IC₅₀ 分别是 70 nM 和 60 nM，比 PD 98059 的抑制活性高 100 倍左右，而对其他 MAPK 激酶如 PKC、Ab1、Raf、MEKK、ERK 和 JNK 等没有或微弱抑制作用。U0126 具有抗炎作用，抑制 AP-1 转录，并抑制多种参与炎症反应的细胞因子和金属蛋白酶活性。在小鼠哮喘模型中，U0126 显著抑制 OVA 诱导的总细胞数增加，并显著降低血清中总 IgE、OVA 特异的 IgE 和 IgG1 水平，组化结果显示，U0126 明显抑制 OVA 诱导的肺组织嗜酸细胞增多，及 VCAM-1 表达。

【该产品仅用于科研实验，不能用于人体】

产品性质

化学名 (Chemical Name)	2,3-bis[amino[(2-aminophenyl)thio]methylene]-butanedinitrile
靶点 (Target)	MEK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	109511-58-2
分子式 (Molecular Formula)	C ₁₈ H ₁₆ N ₆ S ₂
分子量 (Molecular Weight)	380.5
外观 (Appearance)	结晶粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于 -20 ℃，有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 -20 ℃ 避光保存，避免反复冻存，至少可存放 6 个月。

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) 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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

为检测 U0126 对细胞的作用，不同浓度的 U0126 和谷氨酸孵育 HT22 细胞，MTT 检测细胞活力，发现 U0126 抑制谷氨酸毒性诱导的细胞死亡，在 10 μ M 时完全抑制细胞损伤。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，给雄性 BALB/c 小鼠腹腔注射 20 μ g OVA，OVA 显著提高细胞总数和嗜酸性粒细胞数量，而用 U0126（7.5、15、30 mg/kg）处理小鼠后，U0126 显著降低细胞总数，嗜酸性粒细胞数量也显著降低，该作用方式为剂量依赖型。^[4]

参考文献

- [1] Favata MF, et al. Identification of a novel inhibitor of mitogen-activated protein kinase kinase*. The Journal of Biological Chemistry 273 (29): 18623-18632 (1998).
- [2] Duncia JV, et al. MEK inhibitors: the chemistry and biological activity of U0126, its analogs, and cyclization products. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 8(20): 2839-2844 (1998).
- [3] DeSilva DR, et al. Inhibition of mitogen-activated protein kinase kinase blocks T cell proliferation but does not induce or prevent anergy. J Immunol. 160(9): 4175-4181 (1998).
- [4] Duan W, et al. Anti-Inflammatory Effects of Mitogen-Activated Protein Kinase Kinase Inhibitor U0126 in an Asthma Mouse Model. J Immunol 172: 7053-7059 (2004).