

HB181218

## PLX-4720

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
PLX-4720	52011ES10	10 mg
PLX-4720	52011ES25	25 mg

### 产品描述

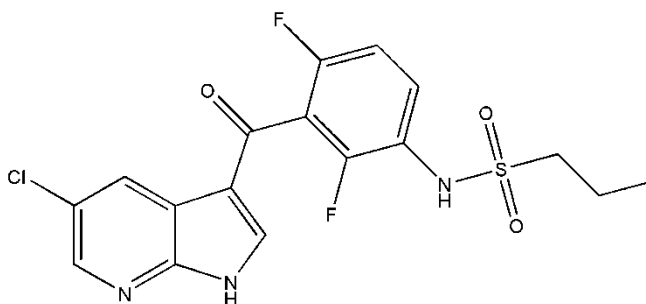
PLX-4720 是 PLX4032 (Vemurafenib) 的结构类似物, 也是一种有效的、选择性 B-RafV600E 抑制剂, IC<sub>50</sub> 为 13 nM, 比作用于野生型 B-Raf 选择性高 10 倍。在 B-Raf<sup>V600E</sup> 阳性肿瘤细胞中, PLX-4720 强效抑制 ERK 磷酸化, 诱导细胞周期阻断和细胞凋亡。在 B-Raf<sup>V600E</sup> 阳性肿瘤移植瘤模型中, PLX-4720 显著引起肿瘤生长延迟, 引起肿瘤衰退, 而且无明显的毒性反应。另外, 在含突变 N-RAS 的黑素瘤细胞中, PLX-4720 快速诱导 MEK-ERK1/2 高度活化。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Raf Kinase Inhibitor V, PLX4720
化学名 (Chemical Name)	N-[3-[(5-chloro-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-yl)carbonyl]-2,4-difluorophenyl]-1-propanesulfonamide
靶点 (Target)	B-RafV600E
CAS 号 (CAS NO.)	918505-84-7
分子式 (Molecular Formula)	C <sub>17</sub> H <sub>14</sub> ClF <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S
分子量 (Molecular Weight)	413.83
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输与保存方法

冰袋运输。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 PLX-4720 对黑素瘤细胞的作用，用 PLX-4720（100 nM, 1  $\mu$ M, 10  $\mu$ M）孵育多种黑素瘤细胞系，如 1205Lu、C8161、WM793、WM852 等，PLX-4720 只能抑制含 V600E 突变的细胞中 ERK 活性，而野生型 B-RAF 细胞中 ERK 保持不变。另外，含 V600E 突变的细胞生长速率降低。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内研究）

在体内实验中，建立 COLO205 移植瘤模型，给小鼠口服 5、20 mg/kg PLX-4720，20 mg/kg PLX-4720 显著抑制肿瘤生长，而且，抑制磷酸化 ERK（43%）。<sup>[1]</sup>

## 参考文献

- [1] Tsai J, et al. Discovery of a selective inhibitor of oncogenic B-Raf kinase with potent antimelanoma activity. Proc Natl Acad Sci U S A, 105(8): 3041-3046 (2008).
- [2] Paraiso KH, et al. PTEN loss confers BRAF inhibitor resistance to melanoma cells through the suppression of BIM expression. Cancer Res, 71(7): 2750-2760 (2011).
- [3] Nucera C, et al. B-Raf(V600E) and thrombospondin-1 promote thyroid cancer progression. Proc Natl Acad Sci U S A, 107(23): 10649-10654 (2010).
- [4] Oikonomou E, et al. Selective BRAFV600E Inhibitor PLX4720, Requires TRAIL Assistance to Overcome Oncogenic PIK3CA Resistance. PLoS ONE 6(6): e21632 (2011).
- [5] Kaplan FM, et al. Hyperactivation of MEK-ERK1/2 signaling and resistance to apoptosis induced by the oncogenic B-RAF inhibitor, PLX4720, in mutant N-RAS melanoma cells. Oncogene 30: 366-371 (2011).