

## VX-11e ; VX11e

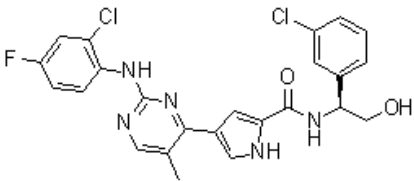
产品编号 : MB5529

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C24H20Cl2FN5O2	结 构 式	
分子量	500.35		
CAS No.	896720-20-0		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 100 mg/mL (199.86 mM) Water : Insoluble Ethanol : 16 mg/mL (31.97 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介 :** VX-11e 是一种高效的, 具有选择性的, 可口服的 ERK 抑制剂。

**别名 :** 1H-Pyrrole-2-carboxamide, 4-[2-[(2-chloro-4-fluorophenyl)amino]-5-methyl-4-pyrimidinyl]-N-[(1S)-1-(3-chlorophenyl)-2-hydroxyethyl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (199.86 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 16 mg/mL (31.97 mM)

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	VX-11e 是一种有效的, 选择性的, 且口服生物可利用的 ERK2 抑制剂, Ki <2 nM, 选择性比作用于其他测试的激酶高 200 倍。
靶点	ERK2 (Cell-free assay) <2 nM(Ki)

体外研究	在 HT29 细胞中，VX-11e 有效抑制细胞增殖，IC50 为 48 nM。
体内研究	在大鼠和小鼠中，VX-11e 表现出良好的口服生物利用度。在负荷人黑色素瘤 RPDx 肿瘤的 NSG 小鼠中，VX-11e (50 mg/kg, p.o.) 导致 pRSK 被强烈抑制，并抑制肿瘤生长。当与 BKM120 结合使用时，VX-11e 导致肿瘤生长抑制显著提高

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5899	GDC0994
MB4560	GSK2656157
MB4567	ISRIB(trans-isomer)

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。VX-11e 是一种高效的，具有选择性的，可口服的 ERK 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9986 mL	9.9930 mL	19.9860 mL
5 mM	0.3997 mL	1.9986 mL	3.9972 mL
10 mM	0.1999 mL	0.9993 mL	1.9986 mL
50 mM	0.0400 mL	0.1999 mL	0.3997 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>ERK 抑制试验:</p> <p>通过分光光度偶联酶试验测定化合物对 ERK2 的抑制。在该试验中，固定浓度的活化 ERK2 (10 nM) 与不同浓度化合物的 DMSO (2.5%) 溶液于 30 °C，在 pH = 7.5，包含 10 mM MgCl<sub>2</sub>，2.5 mM 磷酸烯醇丙酮酸盐，200 μM NADH，150 μg/mL 丙酮酸激酶，50 μg/mL 乳酸脱氢酶和 200 μM erktide 多肽的 0.1 M HEPES 缓冲液中培育 10 分钟。反应通过加入 65 μM ATP 起始。监测 340 nm 下的吸光度减少率。IC50 值根据抑制剂浓度估算。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HT29 细胞</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 细胞增殖通过 3H-胸苷整合法测量。将细胞以 10,000 细胞/孔的浓度使用包含 10% FBS 的生长培养基 RPMI 1640 接种于 96 孔板。加入连续稀释的化合物。细胞和化合物在 37°C 培养箱中培育 48 小时。48 小时后，将 0.4 μCi 3H-胸苷加入每个孔，培育 8 小时，然后将其放回 37°C 培养箱。细胞使用 Tomtec 96-孔细胞采集器采集，CPM 使用 Wallac 1205 BETAPLATE 液体闪烁计数器测定。IC50 是对照组的 50% 抑制值。</p>

<b>动物实验</b>	Animal Models: 负荷人黑色素瘤 RPD <sub>X</sub> 肿瘤的 NSG 小鼠 Formulation: 5% 乙醇, 20% 丙二醇, 7.4% Tween80 Dosages: 50 mg/kg BID Administration: p.o.
-------------	--

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

**活性化合物操作注意事项**

**1 产品分装:** 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

**2 储备液制备:** 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备:** 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂 (如 PBS) 稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会严重影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用:** 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确保 DMSO 的终浓度 < 5%, 以避免毒性作用。给药剂量的时候, 可以参考下表  
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M <sup>2</sup> )	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8

大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

## 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。