

VRT-752271·HCl ; VRT752271

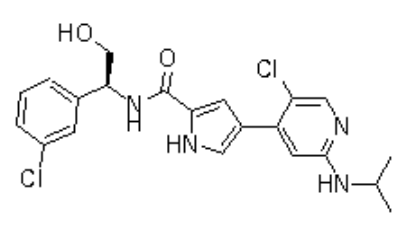
产品编号 : MB7032

质量标准 : >98%, 盐酸盐形式, 蛋白激酶抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₂ Cl ₂ N ₄ O ₂	结 构 式	
分子量	433.33		
CAS No.	869886-67-9 (free base)		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 86 mg/mL (198.46 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol 15 mg/mL (34.61 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 : Ulixertinib (VRT752271) 是一种可逆的, ATP 竞争性的 ERK1, ERK2 抑制剂。

别名 : VRT752271 ; 1H-Pyrrole-2-carboxamide, 4-[5-chloro-2-[(1-methylethyl)amino]-4-pyridinyl]-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 86 mg/mL (198.46 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 15 mg/mL (34.61 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Ulixertinib (BVD-523, VRT752271) 是有效的可逆 ERK1/ERK2 抑制剂, 其抑制 ERK2 的 IC ₅₀ < 0.3 nM。	
靶点	ERK1	ERK2
		<0.3 nM

体外研究	在一个包含 b-RAFV600E 突变体的 A375 黑色素瘤细胞中，Ulixertinib 降低磷酸化的 ERK2 (pERK)水平和下游激酶 RSK (pRSK)的磷酸化水平，IC50 分别为 4.1/0.14 μM 。Ulixertinib 也会抑制 A375 细胞增殖，IC50 为 180 nM。
-------------	--

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
MB3432	SCH772984
MB3652	TIC10 Analogue

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。Ulixertinib (VRT752271) 是一种可逆的，ATP 竞争性的 ERK1，ERK2 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	2.3077 mL	11.5386 mL	23.0771 mL
5 mM	0.4615 mL	2.3077 mL	4.6154 mL
10 mM	0.2308 mL	1.1539 mL	2.3077 mL
50 mM	0.0462 mL	0.2308 mL	0.4615 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	ERK2 催化抑制的 Rapidfire 质谱分析试验: MEK U911 活化的 ERK2 蛋白在组织内部表达并纯化。酶和底物溶液在包含 50 mM Tris (pH 7.5), 10 mM MgCl ₂ , 0.1 mM EGTA, 10 mM DTT 和 0.01% (v/v) CHAPS 的试验缓冲液中制备。1.2 nM ERK2 蛋白质在试验缓冲液中制备, 将 10 μL 加入包含测试和对照品化合物的聚丙烯 384 孔板的每个孔中。化合物板预先加入范围为 100 μM 到 0.1 nM 的 12 个不同剂量, 以计算化合物 IC50s, 与 1%试验化合物中总 DMSO 浓度。酶和化合物在室温下预培养 20 分钟后, 10 μL 底物溶液加入 16 μM Erktide (IPTTPITTTYFFFK)和 120 μM ATP (测量 Km) 组成的试验缓冲液中。反应在室温下进行 20 分钟, 然后加入 80 μL 1% (v/v)甲酸淬灭反应。然后试验板在 RapidFire 质谱分析平台上运行以测量底物(未磷酸化的 Erktide)和产物(磷酸化的 Erktide)。
细胞实验	<p>Cell lines: A375 细胞</p> <p>Concentrations: ~30 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: A375 细胞在 DMEM, 10% (v/v)胎牛血清和 1% (v/v) L-谷氨酰胺组成的细胞培养基中培养。采集后, 将细胞分别加入黑色 384 孔 Costar 板, 在 40μL 总体积的细胞培养基中使每孔含有 200 个细胞, 然后在 37$^{\circ}\text{C}$, 90%相对湿度和 5% CO₂ 旋转式培养基中培养过夜。使用</p>

	<p>Labcyte Echo 555 声控分配器将测试化合物和对照品直接给药至细胞板内部 308 孔。细胞在 30 μM 到 0.03 nM 范围内以 12 个不同浓度给药，计算化合物 IC50s，与 0.3% 试验化合物中总 DMSO 浓度。然后细胞板在 37°C 下培养 72 小时。将细胞中加入 20 μL 含 12% 甲醛的 PBS/A (4% 终浓度) 和 1:2000 稀释的 Hoechst 33342 固定并着色，在室温下培育 30 分钟，然后用 PBS/A 洗涤。使用 Cellomics ArrayScanTM VTI 成像平台在着色的细胞平板上计数细胞。在第 0 天，细胞板依然固定，着色，并读取数据生成细胞计数基线，以测定化合物细胞毒性以及抗增殖作用。</p>
--	--

【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。给药剂量设计时候，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(M2)	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。