

产品名称: VRT752271  
产品别名: Ulixertinib; BVD-523

生物活性:

Description	Ulixertinib (BVD-523; VRT752271) is a potent, orally active, highly selective, ATP-competitive and reversible covalent inhibitor of ERK1/2 kinases, with an IC <sub>50</sub> of <0.3 nM against ERK2. Ulixertinib (BVD-523; VRT752271) inhibits the phosphorylated ERK2 (pERK) and downstream kinase RSK (pRSK) in an A375 melanoma cell line[1][2].				
IC <sub>50</sub> & Target	ERK2	ERK1			
	0.3 nM (IC <sub>50</sub> , at K <sub>M</sub> ATP (60 μM))				
In Vivo	In the pharmacokinetic study, the sensitivity and specificity of the assay are found to be sufficient for accurately characterizing the plasma pharmacokinetics of Ulixertinib (VRT752271) in Balb/C mice[2].				
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b> <b>DMSO : ≥ 45 mg/mL (103.85 mM)</b>  * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div><div>SolventMassConcentration</div><div>1 mM</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
			2.3077 mL	11.5386 mL	23.0771 mL
			0.4615 mL	2.3077 mL	4.6154 mL
			0.2308 mL	1.1539 mL	2.3077 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。  储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。  <b>In Vivo:</b>  请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 <b>In Vitro</b> 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：  ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶  1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.77 mM); Clear solution  此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.77 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。  以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。     2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.77 mM); Clear solution  此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.77 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。  以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
	[1]. Ward RA, et al. Structure-Guided Design of Highly Selective and Potent Covalent Inhibitors of ERK1/2. J Med Chem. 2015 Jun 11;58(11):4790-801.				

References

[2]. Kumar R, et al. Determination of ulixertinib in mice plasma by LC-MS/MS and its application to a pharmacokinetic study in mice. J Pharm Biomed Anal. 2016 Jun 5;125:140-4.



源叶生物