



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

产品名称: **ERK5-IN-2**
CAS 号: **1888305-96-1**
产品货号: **S87625**

生物活性:					
Description		ERK5-IN-2 是一种具有口服活性, 亚微摩尔效力, 选择性的 ERK5 抑制剂, 对 ERK5 和 ERK5 MEF2D 的 IC50s 分别是 0.82 μM, 3 μM。ERK5-IN-2 不与 BRD4 溴结构域相互作用。ERK5-IN-2 抑制肿瘤异种移植生长和 碱性成纤维细胞生长因子 (bFGF) 驱动的基质胶塞血管的生成。			
IC50 & Target[1]		ERK5		ERK5 MEF2D	
		0.82 μM (IC50)		3 μM (IC50)	
Cellular Effect		Cell Line	Type	Value	Description
		HEK293	IC50	3 μM	Inhibition of HA-tagged ERK5 (unknown origin) coexpressed with mutationally activated EGFP-MEK5D and Gal4-MEF2D in HEK293 cells assessed as reduction in MEF2 transcription by measuring luciferase signal after 20 hrs by luciferase reporter gene assay
		Sf9	IC50	0.82 μM	Inhibition of recombinant N-terminal His-tagged human ERK5 (2 to 409 residues) co-expressed with GST-tagged human truncated MEK5DD lacking N-terminal 11 residues (13 to 448 residues) in Sf9 insect cells assessed as substrate peptide phosphorylation using
In Vivo		ERK5-IN-2 (compound 46) (口服; 100 mg/kg; CD1 小鼠 7 天和 CD1 裸 (nu/nu) 小鼠 10 天) 具有抗血管生成作用 and 低浓度的血红蛋白[1]。			
		ERK5-IN-2 (静脉注射或 口服 10 mg/kg, 持续 0.083-24 小时) 在人类和小鼠的 caco-2 细胞渗透性测定中表现出低内在清除率和高通量和低外排比 (ER)[1]。			
		Animal Model:		Female CD1 mice (8-10 weeks old) with Matrigel inoculation and female CD1 nude (nu/nu) mice (8-10 weeks old) bearing A2780 human ovarian carcinoma xenografts[1]	
		Dosage:		100 mg/kg	
		Administration:		P.o.; twice-daily; CD1 mice for 7 days and CD1 nude (nu/nu) mice for 10 days	
		Result:		Tumor volumes were significantly reduced.	
		Animal Model:		Female CD1 mice at 8-10 weeks of age[1]	
		Dosage:		10 mg/kg	
		Administration:		I.v. or p.o.; 0.083-24 hours	
		Result:		The terminal plasma half-life was 38 min, with a plasma clearance of 27 mL/min/kg, and oral bioavailability of 68%.	
Solvent&Solubility		细胞实验:			
		DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (644.01 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
		Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg
					10 mg



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	Preparing	1 mM	2.5761 mL	12.8803 mL	25.7606 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5152 mL	2.5761 mL	5.1521 mL
		10 mM	0.2576 mL	1.2880 mL	2.5761 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°C, 6 months; -20°C, 1 month (protect from light)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。 动物实验： 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 In Vitro 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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.36 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.36 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.36 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。					
参考文献	[1]. Myers SM, et al. Identification of a novel orally bioavailable ERK5 inhibitor with selectivity over p38 α and BRD4. Eur J Med Chem. 2019 May 25;178:530-543.				

完整储备液配制表：

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° C, 6 months; -20° C, 1 month (protect from light)。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5761 mL	12.8803 mL	25.7606 mL	64.4015 mL
	5 mM	0.5152 mL	2.5761 mL	5.1521 mL	12.8803 mL
	10 mM	0.2576 mL	1.2880 mL	2.5761 mL	6.4401 mL
	15 mM	0.1717 mL	0.8587 mL	1.7174 mL	4.2934 mL
	20 mM	0.1288 mL	0.6440 mL	1.2880 mL	3.2201 mL
	25 mM	0.1030 mL	0.5152 mL	1.0304 mL	2.5761 mL
	30 mM	0.0859 mL	0.4293 mL	0.8587 mL	2.1467 mL
	40 mM	0.0644 mL	0.3220 mL	0.6440 mL	1.6100 mL
	50 mM	0.0515 mL	0.2576 mL	0.5152 mL	1.2880 mL
	60 mM	0.0429 mL	0.2147 mL	0.4293 mL	1.0734 mL
	80 mM	0.0322 mL	0.1610 mL	0.3220 mL	0.8050 mL
	100 mM	0.0258 mL	0.1288 mL	0.2576 mL	0.6440 mL

源叶