

HB220126

VX-11e

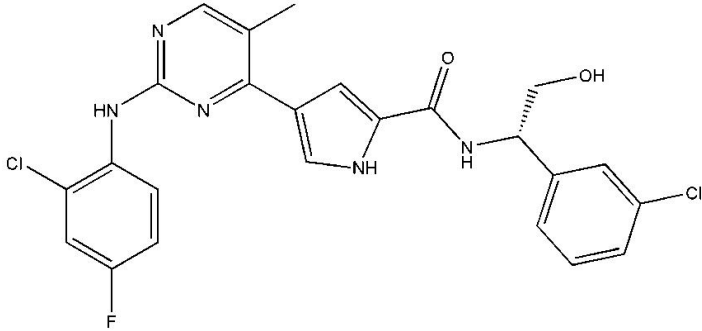
产品信息

产品名称	产品编号	规格
VX-11e	52016ES08	5 mg
	52016ES10	10 mg

产品描述

VX-11e 又称为 TCS ERK 11e, 是一种有效的、选择性 ERK 抑制剂, 抑制 BRAFV600E 突变的黑色素瘤细胞, 平均 GI₅₀ 值为 0.77 μ M, 并有效抑制 HT29 细胞增殖, IC₅₀ 值为 48 nM。在大鼠和小鼠中, VX-11e 表现出良好的口服生物活性。在负荷人黑色素瘤 RPDx 肿瘤的 NSG 小鼠中, VX-11e 导致 pRSK 被强烈抑制, 并抑制肿瘤生长。与 BKM120 联合使用时, VX-11e 抑制肿瘤生长的作用显著提高。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	TCS ERK 11e; VX 11e; vx11 e; tcs erk 11e; VTX-11e; Vertex-11e; 4-[2-[(2-chloro-4-fluorophenyl)amino]-5-methyl-4-pyrimidinyl]-N-[(1S)-1-(3-chlorophenyl)-2-hydroxyethyl]-1H-pyrrole-2-carboxamide
靶点 (Target)	ERK
CAS 号 (CAS NO.)	896720-20-0
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ FN ₅ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	500.35
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻融。

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。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

VX-11e (0-10 μ M) 孵育 HT29 细胞，VX-11e 有效抑制细胞增殖， IC_{50} 值为 48 nM。^[1]VX-11e (10 μ M) 孵育细胞，VX-11e 促使 cyclin D1 蛋白表达降低，降低 pRb 磷酸化。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

体内实验中，建立人源黑色素瘤移植瘤 (PDX) NSG 小鼠模型，VX-11e (50 mg/kg; p.o.) 强效抑制 pRSK，并抑制肿瘤生长。^[3]

参考文献

- [1]. Aronov AM, et al. Structure-Guided Design of Potent and Selective Pyrimidylpyrrole Inhibitors of Extracellular Signal-Regulated Kinase (ERK) Using Conformational Control. *J. Med. Chem.*, 52 (20): 6362–6368 (2009).
- [2]. Carlino MS, et al. Differential activity of MEK and ERK inhibitors in BRAF inhibitor resistant melanoma. *Molecular Oncology* 8(3): 544–554 (2014).
- [3]. Krepler C, et al. Personalized Preclinical Trials in BRAF Inhibitor-Resistant Patient-Derived Xenograft Models Identify Second-Line Combination Therapies. *Clin Cancer Res.* 22(7): 1592-1602 (2015).