



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

产品名称: **ERK5-IN-1**
产品别名: **ERK5-IN-1**

生物活性:

Description	ERK5-IN-1 is a potent ERK5 inhibitor with an IC ₅₀ of 87±7 nM. ERK5-IN-1 also inhibits LRRK2[G2019S] with an IC ₅₀ of 26 nM.				
IC ₅₀ & Target	ERK5	LRRK2[G2019S]			
	87 nM (IC ₅₀)	26 nM (IC ₅₀)			
In Vitro	ERK5-IN-1 (Compound 5) exhibits a cellular EC ₅₀ for inhibiting epidermal growth factor (EGF) induced ERK5 autophosphorylation of 0.19±0.04 μM[1].				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 100 mg/mL (217.61 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1761 mL	10.8804 mL	21.7609 mL
		5 mM	0.4352 mL	2.1761 mL	4.3522 mL
		10 mM	0.2176 mL	1.0880 mL	2.1761 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。 -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。 In Vivo: 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。 1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.98 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (5.98 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀, 向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.98 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (5.98 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 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。 3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil				



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

	<p>Solubility: ≥ 2.75 mg/mL (5.98 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.75 mg/mL (5.98 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。</p>
References	[1]. Deng X, et al. Structural determinants for ERK5 (MAPK7) and leucine rich repeat kinase 2 activities of benzo[e]pyrimido-[5,4-b]diazepine-6(11H)-ones. Eur J Med Chem. 2013;70:758-767.
实验参考:	
Kinase Assay	Kinase activity is determined in an assay volume of 40 μ L in kinase buffer (50 mM Tris-HCl, pH 7.5, 0.1 mM EGTA, 1 mM 2-mercaptoethanol) containing 200 ng of pure active ERK5 and the indicated amount of inhibitor. Reaction started by adding 10 mM magnesium acetate, and 50 μ M [γ - 32 P]-ATP (500 cpm/pmol) and 250 μ M PIMtide (ARKKRRHPSGPPTA) as substrates. Assays are carried out for 20 min at 30°C, terminated by applying the reaction mixture onto p81 paper and the incorporated radioactivity measured ^[1] .
References	[1]. Deng X, et al. Structural determinants for ERK5 (MAPK7) and leucine rich repeat kinase 2 activities of benzo[e]pyrimido-[5,4-b]diazepine-6(11H)-ones. Eur J Med Chem. 2013;70:758-767.

源叶生物