

PH-797804

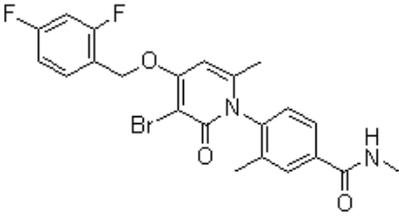
产品编号：MB1650

质量标准：>98%,BR,可用于细胞培养

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：固体

基本信息

分子式	C22H19BrF2N2O3	结构式	
分子量	477.30		
CAS No.	586379-66-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 96 mg/mL (201.13 mM) Water Insoluble Ethanol : 7 mg/mL (14.66 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：PH-797 804 是一种新型吡啶酮 p38 α 抑制剂，其 IC50 为 26 nm，4 倍以上的选择性与 p38 β 相比，不抑制 JNK2。

别名：4-dimethyl-benzamide；PH 797804；

3-Bromo-4-[(2,4-difluorobenzyl)oxy]-1-[5-[(methylamino)carbonyl]-2-methylphenyl]-6-methylpyridin-2(1H)-one, 3-[3-Bromo-4-[(2,4-difluorophenyl)methoxy]-6-methyl-2-oxo-1(2H)-pyridinyl]-N

物理性状及指标：

外观：.....固体

含量：.....>98%

溶解性：.....DMSO : 96 mg/mL (201.13 mM)；Water Insoluble；Ethanol : 7 mg/mL (14.66 mM)

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PH-797804 是一种新型吡啶酮 p38α 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 26 nM；比作用于 p38 β 选择性高 4 倍以上，不抑制 JNK2。					
靶点	<table border="1"> <tr> <td>p38α (Cell-free assay)</td> <td>p38β (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>26 nM</td> <td>102 nM</td> </tr> </table>	p38 α (Cell-free assay)	p38 β (Cell-free assay)	26 nM	102 nM	
p38 α (Cell-free assay)	p38 β (Cell-free assay)					
26 nM	102 nM					
体外研究	PH-797804 作用于人类单核 U937 细胞系，阻断 LPS 诱导的 TNF- α 产生和 p38 激酶活性，IC50 为 5.9 和 1.1 nM。浓度高达 1 μ M 作用于 U937 细胞 JNK 通路(c-Jun 磷酸化)或 ERK 通路(ERK 磷酸化)观察不到抑制效果。PH-797804 作用于原代大鼠骨髓细胞，抑制 RANKL-和 M-CSF 诱导的破骨细胞形成，这种作用存在浓度依赖性，IC50=3 nM。PH-797804 作用于以下靶点的 IC50 值大于 200 μ M: CDK2, ERK2, IKK1, IKK2, IKKi, MAPKAP2, MAPKAP3, MKK7 (>100 μ M), MNK, MSK (>164 μ M), PRAK, RSK2, 及 TBK1,说明 PH-797804 的活性是特定的。					

体内研究	Endotoxin 全身给药大鼠和食蟹猴，引起的急性炎症反应可通过口服 PH-797804 得到有效抑制。PH-797804 治疗模型疾病模型，处理 10 天，具有强大的抗炎活性，作用于链球菌细胞壁诱导的关节炎及大小鼠胶原诱导的关节炎，显著降低关节发炎和相关的骨质流失。剂量-反应分析显示作用于大鼠和食蟹猴的 ED50 分别为 0.07 mg/kg 和 0.095 mg/kg。PH-797804 作用于人类 Endotoxin 挑战模型，抑制 LPS 诱导的 TNF- α , IL-6, 和 MK-2 活性，这种作用存在剂量和浓度依赖性。
-------------	--

美仑相关产品推荐

MB4046	VX-702
MB4048	VX-745
MB1084	达马莫德;BIRB796

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。是一种新型吡啶酮 p38 α 抑制剂，可用于相关领域的科学研究。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0951 mL	10.4756 mL	20.9512 mL
5 mM	0.4190 mL	2.0951 mL	4.1902 mL
10 mM	0.2095 mL	1.0476 mL	2.0951 mL
50 mM	0.0419 mL	0.2095 mL	0.4190 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	P38 激酶检测: 使用树脂捕获检测法测定 p38 激酶引起的表皮生长因子受体肽(EGFRP)或 GST-c-Jun 的磷酸化。反应混合物含 25 mM HEPES, pH 7.5, 10 mM 醋酸镁, ATP (按指定浓度), 0.05 到 0.3 μ Ci [γ -33P]ATP, 0.8 mM 二硫苏糖醇, 及 200 μ M EGFRP 或 10 μ M GST-c-Jun 用于 p38 α 激酶反应。加入 25 nM p38 α 激酶反应开始, 终体积为 50 μ l。p38 α 激酶反应在 25 $^{\circ}$ C 下进行 30 分钟。在这些条件下, p38 α 激酶的产物形成与时间成线性关系。反应停止, 在 900 mM 甲酸钠, pH 3.0 中加入 150 μ l AG 1 \times 8 离子交换树脂移除未反应的 [γ -33P]ATP。一旦充分混合, 溶液精致 5 分钟。50- μ l 含磷酸化的底物从混合物中移除, 转移到 96 孔板中。每孔加入 MicroScint-40 闪烁液 (150 μ l), 使用 TopCount NXT 微板闪烁和发光计数器测定放射活性。
细胞实验	Cell lines: 类风湿关节炎滑膜成纤维细胞 (S) Concentrations: -- Incubation Time: -- Method: 使用 MTT 法测定细胞活力。使用 ELISA 酶标仪在实验波长为 570 nm, 参考波长为 630 nm 的情况下测定吸光值。
动物实验	Animal Models: LPS 诱导的慢性炎症大鼠模型 Formulation: PH-797804 在 0.5%甲基纤维素和 0.025% Tween-20 中制备成悬浮液 Dosages: 0.001-1 mg/kg Administration: 口服饲喂

【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。