

Pamapimod (R-1503, Ro4402257)

产品编号: MB2608

质量标准: >98%,BR

包装规格: 1mg/5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₁₉ H ₂₀ F ₂ N ₄ O ₄	结构式	
分子量	406.38		
CAS No.	449811-01-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H ₂ O : Insoluble		
	DMSO: 81 mg/mL (199.32 mM)		
	Ethanol: 28 mg/mL (68.90 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: Pamapimod (R-1503, Ro4402257)是新型的、选择性的 p38 MAPK 抑制剂。它能抑制 p38α和 p38β, IC₅₀ 分别为 0.014±0.002 和 0.48± 0.04 μM。对 p38delta 和 p38gamma 没有活性。

物理性状及指标:

外观:粉末

 溶解性:H₂O : Insoluble; DMSO: 81 mg/mL (199.32 mM); Ethanol: 28 mg/mL (68.90 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Pamapimod (R-1503, Ro4402257)是新型的、选择性的 p38 MAPK 抑制剂。它能抑制 p38α和 p38β, IC ₅₀ 分别为 0.014±0.002 和 0.48± 0.04 μM。对 p38delta 和 p38gamma 没有活性。		
IC₅₀ & Target	p38α (Cell-free assay)	p38β (Cell-free assay)	
	0.014 μM	0.48 μM	
体外	Pamapimod 抑制 p38, 但没有观测到 JNK 被抑制。Pamapimod 也能抑制 LPS 刺激下单核细胞 TNFα的产生、人全血细胞中 IL-1β的生成以及 RA 患者滑膜外植体的自发性 TNFα的产生。		
体内	在小鼠胶原诱导性关节炎中, 50 mg/kg pamapimod 能减少炎症临床症状以及减少骨质流失。在痛觉过敏的大鼠模型中, pamapimod 能增强其耐压力, 说明 p38 在炎症相关的疼痛中的重要作用。Pamapimod 能抑制 RA 患者滑膜外植体的自发性 TNFα的产生。在啮齿类动物中,		

	pamapimod 抑制 LPS-和 TNF α -刺激下 TNF α 和 IL-6 的生成。
细胞实验	<p>Cell lines: 人单核细胞株, THP-1</p> <p>Concentrations: 15 μM</p> <p>Incubation Time: 150 min</p> <p>Method:</p> <p>将生长至对数期的 THP-1 细胞用离心法收集好后, 重悬于含 5.5\times10⁻⁵ M 巯基乙醇及 10%胎牛血清的 RPMI 培养基中, 最终细胞密度为 2.5\times10⁶ cells/ml。预先配好 25 μL 稀释好的 pamapimod 溶液, 在加入到细胞前, 先加至圆底 96 孔板中。最开始的浓度为 100 μM (5% DMSO), 然后配置 6 个半对数稀释浓度进行处理。每孔加入 200 μL 细胞悬浮液和 25 μL 5μg/ml 的 LPS 到培养基中, DMSO 的终浓度为 0.5%, 化合物再稀释 10 倍, LPS 终浓度为 500 ng/ml。将细胞悬浮液和化合物稀释液混合在一起, 在 37$^{\circ}$C、5% CO₂ 的细胞培养箱中共同孵育 30 分钟。然后加入 LPS, 孵育 2 小时, 离心, 将细胞上清液储存于 4 度, 用于分析 TNF-alpha 含量。</p> <p>(Only for Reference)</p>
动物实验	<p>Animal Models: BALB/c 小鼠</p> <p>Formulation: 0.9% NaCl, 0.5% 羧甲基纤维素钠, 0.4% 聚山梨醇酯 80, 0.9% 苯甲醇, 97.3% 蒸馏水</p> <p>Dosages: 25, 50, 100, 150 mg/kg</p> <p>Administration: 口服</p> <p>(Only for Reference)</p>

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1084	达马莫德;BIRB796
MB1650	PH-797804
MB2609	Losmapimod (GW856553X)

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热 (在 45-60 $^{\circ}$ C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20 $^{\circ}$ C 1-3 月; -80 $^{\circ}$ C 3-6 月。

浓度	DMSO 质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4608 mL	12.3038 mL	24.6075 mL
5 mM	0.4922 mL	2.4608 mL	4.9215 mL
10 mM	0.2461 mL	1.2304 mL	2.4608 mL
50 mM	0.0492 mL	0.2461 mL	0.4922 mL

- 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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。产品标签标示重量会有一定误差, 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。