

Losmapimod (GW856553X)

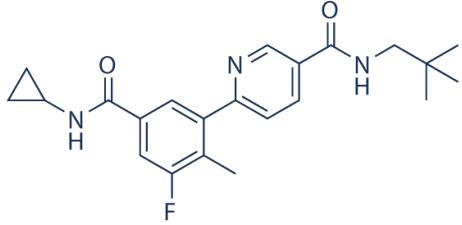
产品编号: MB2609

质量标准: >98%,BR

包装规格: 10mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C22 H26 F N3 O2	结 构 式	
分子量	383.46		
CAS No.	585543-15-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 76 mg/mL (198.20 mM)		
	Ethanol: 76 mg/mL (198.20 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
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: Losmapimod 是口服有效的选择性 p38 MAPK 抑制剂, 其作用于 p38 α 和 p38 β 的 pKi 分别为 8.1 和 7.6。Phase 3.

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; DMSO: 76 mg/mL (198.20 mM); Ethanol: 76 mg/mL (198.20 mM) (warmed with 50℃ water bath)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Losmapimod 是口服有效的选择性 p38 MAPK 抑制剂, 其作用于 p38 α 和 p38 β 的 pKi 分别为 8.1 和 7.6。Phase 3.		
IC50 & Target	p38 α (Cell-free assay)	p38 β (Cell-free assay)	
	8.1(pKi)	7.6(pKi)	
体内	在自发性高血压易卒型大鼠(SHR-SP)体内, Losmapimod 显著提高存活率, 内皮细胞依赖性和非依赖性血管舒张作用, 以及肾功能指数, 随后减弱血脂异常, 高血压, 心脏重塑, 血浆肾素活性(PRA), 醛固酮, 以及白细胞介素-1 β (IL-1 β)。		
动物实验	Animal Models: 自发性高血压易卒型大鼠		

Formulation: --
Dosages: ~12 毫克/千克
Administration: 口服 (Only for Reference)

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
MB2608	Pamapimod (R-1503, Ro4402257)

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°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°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 积 浓度	DMSO 质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6078 mL	13.0392 mL	26.0783 mL
5 mM	0.5216 mL	2.6078 mL	5.2157 mL
10 mM	0.2608 mL	1.3039 mL	2.6078 mL
50 mM	0.0522 mL	0.2608 mL	0.5216 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。