

Valdecoxib ; 伐地考昔

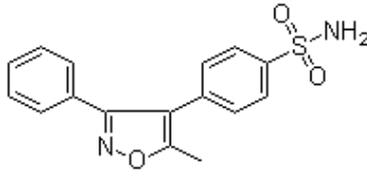
产品编号 : MB3967

质量标准 : >99%

包装规格 : 200MG ; 1G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C16H14N2O3S	结 构 式	
分子量	314.36		
CAS No.	181695-72-7		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO>60mg/ml Water insoluble Ethanol>15mg/ml		
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 : 伐地考昔 Valdecoxib 是一种高效的, 可口服的, 选择性的 COX-2 抑制剂, 作用于 COX-2 和 COX-1, 可用于关节炎和疼痛的研究。

别名 : SC 65872 ; Valdecoxib ; 伐地考昔 ; Benzenesulfonamide, 4-(5-methyl-3-phenyl-4-isoxazolyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO>60mg/ml ; Water insoluble ; Ethanol>15mg/ml

含量 :>99%

储存条件 : 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	是一种强有效和选择性的 COX-2 抑制剂
靶点	COX-2 5 nM
体外研究	Valdecoxib 抑制 LPS 诱导的血浆中 PGE ₂ 产生, 对 COX-2 抑制程度评估, IC ₅₀ 为 0.89 μM。Valdecoxib 抑制血浆中 TxB ₂ 产生, 对 COX-1 抑制程度评估, IC ₅₀ 为 25.4 μM。Valdecoxib 与

	<p>COX-2 结合, K_a 为 1.1×10^5 M/s。Valdecoxib 对 COX-2 的总体的饱和结合亲和力为 2.6 nM。Valdecoxib 在人全血 COX 测定(COX-2 IC₅₀ = 0.24 μM; COX-1 IC₅₀ = 21.9 μM)中,表现出相似的活性。 [³H]Valdecoxib 对 COX-2 的亲和力, K_D 为 3.2 nM。Valdecoxib 与 COX-2 的结合似乎快速而缓慢可逆, 结合速率为 4.5×10^6/M/min, 解离速率为 7.0×10^{-3}/min ($t_{1/2}$ of 98 min)。溶解的 Valdecoxib 的百分比在 15 分钟(DP₁₅)时对 Valdecoxib 是 10.5%, 对其亲水性衍生物(VALD-βCd, VALD-HPβCd 和 VALD-SBE7βCd 复合物)分别为 50%, 91%和 93%。</p>
体内研究	<p>Valdecoxib 口服给药抑制大鼠角叉菜胶脚垫水肿, ED₅₀ 为 10.2 毫克/千克。在大鼠非特异性关节炎模型中, Valdecoxib 口服给药具有慢性抗炎活性, ED₅₀ 为 0.032 毫克/千克/天。在大鼠角叉菜胶气囊炎模型中, Valdecoxib 口服给药能够阻滞炎症部位前列腺素的产生, ED₅₀ 为 0.02 毫克/千克。Valdecoxib 在急慢性炎症大鼠模型中显示出显著的效力(气囊炎 ED₅₀ = 0.06 毫克/千克; 足肿胀 ED₅₀ = 5.9 毫克/千克; 非特异性关节炎 ED₅₀ = 0.03 毫克/千克)。Valdecoxib 单独在体内吸收较慢, 在 3 小时后, 抑制对水肿的最大百分比为 16%。相反, VALD-βCd 和 VALD-SBE7βCd 复合物在体内具有高吸收率, 在 1 小时内能够抑制超过 50%的水肿, 3 小时后, 抑制水肿的最大百分比为 66%。Valdecoxib (5 毫克/千克, 口服)导致雄性和雌性大鼠体内血浆中 AUC 分别为 3.58 微克*小时/毫升和 2.08 微克*小时/毫升。Valdecoxib (5 毫克/千克, 口服)导致雄性和雌性大鼠体内红细胞中 AUC 分别为 12.1 微克*小时/毫升和 6.42 微克*小时/毫升。</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)

MB3613	NS398
MB8193	Rofecoxib
MB4600	地拉考昔

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。伐地考昔 Valdecoxib 是一种高效的, 可口服的, 选择性的 COX-2 抑制剂, 作用于 COX-2 和 COX-1, 可用于关节炎和疼痛的研究。

储液配置:

体质量	浓度		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.1811 mL	15.9053 mL	31.8107 mL
5 mM	0.6362 mL	3.1811 mL	6.3621 mL
10 mM	0.3181 mL	1.5905 mL	3.1811 mL
50 mM	0.0636 mL	0.3181 mL	0.6362 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: 雄性 Sprague-Dawley 大鼠 Formulation: 0.5%甲基纤维素和 0.025% Tween-20 Dosages: 10.2 毫克/千克 Administration: 口服
-------------	---

【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，否则会严重影响化合物活性，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(M ²)	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。