

VX-745

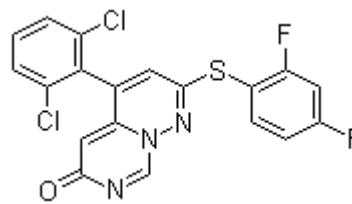
产品编号: MB4048

质量标准: >98%, p38 α 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C19H9Cl2F2N3OS	结 构 式	
分子量	436.26		
CAS No.	209410-46-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 15 mg/mL (34.38 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
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: VX-745 是有效的, 有选择性的 p38 α 抑制剂, 具有抗炎活性。

别名: Neflamapimod; 6H-Pyrimido[1,6-b]pyridazin-6-one,

5-(2,6-dichlorophenyl)-2-[(2,4-difluorophenyl)thio]-

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 15 mg/mL (34.38 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	VX-745 是有效的, 选择性 p38 α 抑制剂, IC ₅₀ 为 10 nM, 比作用于 p38 β 选择性高 22 倍, 对 p38 γ 没有抑制作用。	
靶点	p38 α MAPK	p38 β MAPK
IC₅₀	10 nM	0.22 μ M
体外研究	VX-745 选择性抑制 p38 α 和 p38 β MAPK, IC ₅₀ 分别为 10nM 和 220 nM, 但是对 p38 γ MAPK 和其他激酶没有作用效果, IC ₅₀ 大于 20 μ M。人类外周血管单核细胞(PBMC)实验中, VX-745 抑制 IL-1 β 和 TNF 时 IC ₅₀ 分别为 56 和 52nM。VX-745 抑制 IL-1 和 TNF α 诱导的 IL-6 和 IL-8 产生, 且抑制 LPS 和 IL-1 β 调节的 COX-2 合成。60 nM-20 μ M VX-745 作用于骨髓基质细胞(BMSCs), 抑制 IL-6 和 VEGF 分泌, 不影响细胞的生存能力。VX-745 作用于 BMSCs 也抑制 TNF- α 诱导的 IL-6 分泌。VX-745 作用于 BMSCs, 通过 MM 细胞粘附到 BMSCs, 抑制 MM 细胞增殖和 IL-6 分泌, 说明 VX-745 能抑制旁分泌 MM 细胞生长, 且能克服细胞粘附相关耐药性	

体内研究	VX-745 有效治疗鼠的佐剂性关节炎, ED50 为 5 mg/kg。VX-745 作用于佐剂性关节炎鼠, 抑制骨重吸收达 93%, 抑制炎症发生达 56%。VX-745 作用于软骨诱导性关节炎, 呈现剂量反应降低。2.5, 5, 和 10 mg/kg VX-745 作用于 II 型胶原诱导的关节炎鼠模型, 与对照组相比, 在炎症作用方面分别提高 27%, 31%, 和 44%。此外, VX-745 保护 32-39% 的骨骼和软骨。
特征	VX-745 是有效的, 选择性 p38α 和 p38β MAPK 抑制剂。

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)

MB4047	TAK-715
MB8816	LY2228820
MB4073	SB202190 (FHPI)

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。VX-745 是有效的, 有选择性的 p38α 抑制剂, 具有抗炎活性。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓 度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2922 mL	11.4611 mL	22.9221 mL
5 mM	0.4584 mL	2.2922 mL	4.5844 mL
10 mM	0.2292 mL	1.1461 mL	2.2922 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	光度偶联酶实验: 通过光度偶联酶实验获得抑制 p38α 和 p38β 同系物的 IC50 值。在 0.1 M HEPES buffer [pH 为 7.5, 包含 10%甘油, 10 mM MgCl₂, 2.5 mM 烯醇丙酮酸磷酸, 200 μM NADH, 150 μg/mL 丙酮酸激酶, 50 μg/mL 乳酸脱氢酶, 及 200 μM EGF 受体肽(KRELVEPLTPSGEAPNQALLR)]中, 混合浓度的酶(15 nM p38α 或 p38β)和溶于 DMSO 的 VX-745 在 30°C 下温育 10 分钟。加入 100 μM (p38α) 和 70 μM ATP (p38β)反应开始。340nm 处测定的吸光值随反应速率而降低。测定 IC50 值。
细胞实验	Cell lines: 人类骨髓基质细胞 (BMSCs)和多发性骨髓瘤(MM)细胞 Concentrations: 60 nM-20 μM, 溶于 DMSO. Incubation Time: 48 小时 Method: BMSCs(每孔 5×10⁴ 个细胞)或 MM 细胞(每孔 3×10⁴个细胞)在 96 孔板上 37 °C 下温育 48 小时。测定 [³H]-胸苷([³H]TdR)摄入率而测定 DNA 合成。细胞和[³H]TdR (每孔 0.5 μCi) 在 48 小时培养期的最后 8 小时进行脉冲处理。测定 MTT 染料吸光值而测定 VX-745 抑制 MM 细胞和 BMSCs 生长的效果。
动物实验	Animal Models: II 型胶原诱导的关节炎(CIA)鼠模型 (DBA/1J) Formulation: 溶于 100%聚乙二醇 Dosages: 2.5, 5, 和 10 mg/kg Administration: 口服饲喂, 每天两次

【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(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。