

## SB203580

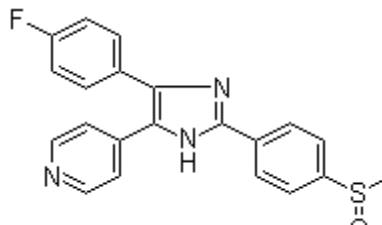
产品编号: MB5062

质量标准: >98%, p38 MAPK 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C21H16FN3OS	结构式	
分子量	377.43		
CAS No.	152121-47-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 43 mg/mL (113.92 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:** SB 203580 是一种广泛使用的 p38 MAPK 抑制剂且阻断 PKB 磷酸化。

**别名:** RWJ 64809; Pyridine, 4-[4-(4-fluorophenyl)-2-[4-(methylsulfinyl)phenyl]-1H-imidazol-5-yl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至淡黄色固体

溶解性: .....DMSO: 43 mg/mL (113.92 mM); Water Insoluble; Ethanol: Insoluble

含量: .....>98%

**储存条件:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	SB203580 是一种 p38 MAPK 抑制剂, 在 THP-1 细胞中 IC50 为 0.3-0.5 μM, 对 SAPK3(106T) 和 SAPK4(106T) 选择性低 10 倍, 且阻断 PKB 磷酸化, IC50 为 3-5 μM。					
<b>特性</b>	SB203580 是第一个被报道的 p38 抑制剂。					
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>p38 MAPK (THP-1 cells)</td> <td>PKB (THP-1 cells)</td> </tr> <tr> <td>0.3 μM-0.5 μM</td> <td>3 μM-5 μM</td> </tr> </table>	p38 MAPK (THP-1 cells)	PKB (THP-1 cells)	0.3 μM-0.5 μM	3 μM-5 μM	
p38 MAPK (THP-1 cells)	PKB (THP-1 cells)					
0.3 μM-0.5 μM	3 μM-5 μM					
<b>体外研究</b>	SB203580 作用于人类 T 细胞, 鼠 CT6 T 细胞, 或 BAF F7 B 细胞, 抑制 IL-2 诱导的增殖, IC50 为 3-5 μM。SB203580 也抑制 IL-2 诱导的 p70S6K 激活, IC50 > 10 μM。SB203580 也抑制 PDK1 活性, IC50 为 3-10 μM, 这种抑制存在剂量依赖性。SB203580 抑制 MAPKAPK2 中 p38-MAPK 的刺激, IC50 为 0.07 μM, 然而抑制完整 SAPK/JNK 活性时, IC50 为 3-10 μM。SB203580 高浓度时激活 ERK 通路, 随后增强 NF-κB 转录活性。SB203580 作用于人类肝癌细胞(HCC), 诱导					

	自体吞噬。
体内研究	SB203580 作用于缺血性损伤，保护猪的心肌层。SB203580 有效保护携带系统性红斑狼疮的 MRL/lpr 鼠和治疗疾病。

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
MB4046	VX-702
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。SB 203580 是一种广泛使用的 p38 MAPK 抑制剂且阻断 PKB 磷酸化。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.6495 mL	13.2475 mL	26.4950 mL
5 mM		0.5299 mL	2.6495 mL	5.2990 mL
10 mM		0.2649 mL	1.3247 mL	2.6495 mL
50 mM		0.0530 mL	0.2649 mL	0.5299 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	<p>细胞受体激酶磷酸化实验：</p> <p>4 μg 羊 PKBα 抗体固定在 25 μL 蛋白 G-亲和层析柱上过夜(或 1.5 小时)，用 Buffer A (50 mM Tris, pH 为 7.5, 1 mM EDTA, 1 mM EGTA, 0.5 mM Na<sub>3</sub>VO<sub>4</sub>, 0.1% β-巯基乙醇, 1% Triton X-100, 50 mM NaF, 5 mM 焦磷酸钠, 0.1 mM 苯甲磺酰氟, 1 μg/mL 抑蛋白酶肽, 抑肽素, 亮抑酶肽, 及 1 μM 微囊藻素) 冲洗。固定的 PKB 抗体和 0.5 ml 细胞溶解物温育 1.5 小时, 用含 0.5 M NaCl 的 0.5 mL Buffer A 冲洗三次, 再用 0.5 mL Buffer B (含 50 mM Tris-HCl, pH 为 7.5, 0.03% (w/v) Brij-35, 0.1 mM EGTA, 及 0.1% β-巯基乙醇) 冲洗二次, 最后用 100 μL 实验稀释 buffer 冲洗二次; 5×实验稀释 buffer 包含 100 mM MOPS, pH 为 7.2, 125 mM β-甘油磷酸, 25 mM EGTA, 5 mM 原钒酸钠, 及 5 mM DTT。10 μL 实验稀释 buffer, 40 μM 蛋白激酶 A 抑制肽, 100 μM PKB-特定底物肽, 及 10 μCi [γ-<sup>32</sup>P]ATP, 加到 PKB 酶免疫复合物中。反应在室温下震荡温育 20 分钟, 40 μL 反应物转移到其他试管中, 加入 20 μL 40%三氯乙酸, 终止反应。在室温下混合, 温育 5 分钟, 40 μL 转移到 P81 磷酸纤维素纸上, 亲和处理 30 秒。P81 纸在 0.75%磷酸中洗三次, 然后在室温下加到丙酮中。使用闪烁计数器测量 γ-<sup>32</sup>P 渗透率。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: CT6 细胞, BA/F3 F7 细胞</p> <p>Concentrations: 0-30 μM</p> <p>Incubation Time: 1 小时</p> <p>Method:</p> <p>CT6 细胞和 BA/F3 F7 细胞在 RPMI 培养基中冲洗三次, 然后培养在含 5%胎牛血清, 生长因子, 抗生素, β-巯基乙醇的 RPMI 培养基中。2-5×10<sup>6</sup> 个 CT6 细胞悬浮在含 5%胎牛血清的 2 ml RPMI</p>

	培养基上, 用 SB203580 预处理。然后加入 20 ng/ml 重组人类 IL-2, 在 37 oC 下刺激细胞 5 分钟, 离心 30 秒, 溶解于合适 buffer 中。稳定表达 IL-2 受体 β 链缺失突变的 BA/F3 细胞维持在含谷氨酸, 5%胎牛血清和 0.2 μg/mL G418 的 RPMI 培养基中。大规模冲洗细胞, 过夜处理, 在用 IL-2 激活前再次冲洗。通过测定[3H]胸苷的渗透率, 进行细胞增殖实验。
动物实验	Animal Models: 携带系统性红斑狼疮的雌性 MRL/lpr 鼠和雌性 C57BL/6 鼠 Formulation: 溶于饮用水中(250 μM) Dosages: 0.4mL/天 Administration: 口服处理

**【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。