

SP600125 ; 1,9-吡唑并蒽酮

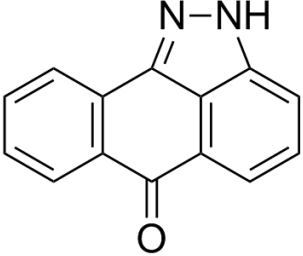
产品编号 : MB5595

质量标准 : HPLC>98%,进分,JNK 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C14H8N2O	结 构 式	
分子量	220.23		
CAS No.	129-56-6		
储存条件	2-8°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 44 mg/mL (199.79 mM) Water Insoluble Alcohol 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 : SP600125 是一种可逆, ATP 竞争性的 JNK 抑制剂, 抑制 JNK1, JNK2 和 JNK3 的 IC₅₀ 分别为 40, 40, 90 nM。

别名 : 吡唑蒽酮; 蒽并[1,9-cd]吡唑-6(2H)-酮;

SP 600125;SP-600125;1,9-Pyrazoloanthrone;Anthra[1,9-cd]pyrazol-6(2H)-one;JNK Inhibitor II

物理性状及指标 :

外观 :黄色至绿色固体

溶解性 :DMSO 44 mg/mL (199.79 mM) ; Water Insoluble ; Alcohol Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : 2-8°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	SP600125 是一种广谱 JNK 抑制剂, 作用于 JNK1, JNK2 和 JNK3, 无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 40 nM, 40 nM 和 90 nM, 比作用于 MKK4 选择性高 10 倍, 比作用于 MKK3, MKK6, PKB, 和 PKCα 选择性高 25 倍, 比作用于 ERK2, p38, Chk1, EGFR 等选择性高 100 倍。				
特性	SP600125 是丝/苏氨酸激酶广谱抑制剂, 有效抑制 c-Jun 氨基末端激酶(JNK)。				
靶点	JNK1 (Cell-free assay)	JNK2 (Cell-free assay)	Aurora A (Cell-free assay)	TrkA (Cell-free assay)	JNK3 (Cell-free assay)
	40 nM	40 nM	60 nM	70 nM	90 nM
体外研究	SP600125 是 ATP 竞争性的 c-Jun 氨基末端激酶(JNK)选择性抑制剂, IC ₅₀ 为 40 nM 到 90 nM。SP600125 作用于 Jurkat T 细胞, 抑制 c-Jun 磷酸化, IC ₅₀ 为 5 μM 到 10 μM。SP600125 作用于 CD4 ⁺ 细胞, 如从人脐血或外周血分离的 Th0 细胞, 抑制细胞活化和分化, 且抑制炎症基因				

	COX-2, IL-2, IL-10, IFN- γ 和 TNF- α 的表达, IC50 为 5 μ M 到 12 μ M。然而,后期研究显示 SP600125 也抑制香烃受体(AhR) Mps1, 和一系列其他丝/苏氨酸激酶, 包括 Aurora 激酶 A, FLT3, MELK,和 TRKA。20 μ M SP600125 作用于小鼠 beta 细胞 MIN6, 诱导 p38 MAPK 磷酸化, 和其下游 CREB 依赖的 启动子的激活。20 μ M SP600125 作用于 HCT116 细胞, 使有丝分裂停在 G2 期, 且诱导核内复制。
体内研究	SP600125 按 15 mg/kg 或 30 mg/kg 剂量作用于小鼠, 显著抑制脂多糖(LPS)诱导的 TNF- α 表达和 CD3 抗体诱导的 CD4 ⁺ CD8 ⁺ 胸腺细胞凋亡。

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)

MB4049	JNK-IN-8
--------	----------

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。SP600125 是一种可逆, ATP 竞争性的 JNK 抑制剂, 抑制 JNK1, JNK2 和 JNK3, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.5407 mL	22.7035 mL	45.4071 mL
5 mM	0.9081 mL	4.5407 mL	9.0814 mL
10 mM	0.4541 mL	2.2704 mL	4.5407 mL
50 mM	0.0908 mL	0.4541 mL	0.9081 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验	<p>体外激酶实验:</p> <p>根据测量放射性磷酸转移到底物中的量, 而测定 SP600125 作用于激酶的效果, 包括 MPS1, JNK, 和 Aurora 激酶 A。使用 5 nM MPS1 重组蛋白在 50 mM HEPES pH 7.5, 2.5 mM MgCl₂, 1 mM MnCl₂, 1 mM DTT, 3 μM NaVO₃, 2 mM β-甘油磷酸, 0.2 mg/mL BSA, 200 μM P38-βtide 底物-肽(KRQADEEMTGYVATR WYRAE), 和含 1.5 nM³³P-γ-ATP 的 8 μM ATP 中测量 MPS1 活性。使用 1:3 稀释的(从 30 μM 稀释成 1.5 nM) SP600125 进行实验, 然后测定 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HCT116, A2780, 和 U2OS 细胞</p> <p>Concentrations: 0-5 μM, 溶于 0.1% DMSO</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 细胞接种在 384 孔板上。实验第一天, 用 SP600125 处理细胞 72 小时, 然后通过 CellTiter-Glo 实验处理实验板。测定与对照组相比, 实验组的抑制活性, 计算抑制增殖的 IC50 值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 雌性 CD-1 小鼠 LPS/TNF 模型</p> <p>Formulation: 溶于 PCES (30% PEG-400/20% 聚丙二醇/15% Cremophor EL/5% 乙醇/30% 盐水)</p> <p>Dosages: 15 或 30 mg/kg</p> <p>Administration: 静脉注射或口服处理</p>

【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(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。