

Rofecoxib

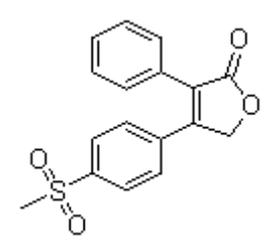
产品编号: MB8193

质量标准: >98%, COX-2 抑制剂

包装规格: 50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C17H14O4S	结 构 式	
分子量	314.36		
CAS No.	162011-90-7		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 63 mg/mL (200.4 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: 罗非考昔 Rofecoxib 是一种有效的, 可口服的 COX-2 特异性抑制剂。

别名: MK 966; 2(5H)-Furanone, 4-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-3-phenyl

物理性状及指标:

外观:淡黄色至绿色固体

溶解性:DMSO: 63 mg/mL (200.4 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Rofecoxib 是一种 COX-2 抑制剂, IC50 为 18 nM。
靶点	COX-2 18 nM
体外研究	Rofecoxib 抑制人骨肉瘤细胞中 COX-2 依赖性 PGE2 的产生, IC50 为 26 nM。Rofecoxib 是一种纯化的人重组 COX-2 的时间依赖性抑制剂, IC50 为 0.34 μM。Rofecoxib 引起纯化的人 COX-1 非时间依赖性抑制。在人全血试验中, Rofecoxib 选择性抑制脂多糖诱导的, COX 衍生的 PGE2 合成, IC50 值为 0.53 μM, 相比而言, 抑制血凝固后 COX-1 衍生的血栓素 B2 的合成, IC50 值为 18.8 μM。Rofecoxib 适度抑制 phenacetin O-脱乙基作用, IC50 为 23 μM。与微粒体和 NADPH 预培养 30 分钟, 显著增加 Rofecoxib 的抑制作用, IC50 为 4.2 μM。CYP1A2 通过 Rofecoxib 的失活需要 NADPH, 并且以 4.8 μM 的 K _i 为特点。
体内研究	Rofecoxib 有效抑制角叉菜胶诱导的足肿胀, 角叉菜胶诱导的足痛觉过敏, 以及脂多糖诱导的热症, IC50 分别为 1.5 mg/kg, 1.0 mg/kg 和 0.24 mg/kg。Rofecoxib 也会阻断佐剂诱导的关节炎,

<p>IC50 为 0.74 mg/kg/day。在大鼠体内, Rofecoxib 也对佐剂诱导的软骨和骨结构损伤具有保护作用。Rofecoxib 口服给药降低用 CCl4 处理 8 周的大鼠门静脉压。此外, 在 CCl4 处理的大鼠中, rofecoxib 给药减少活化 HSCs 的数量, 并下调三个检测型胶原蛋白, 层粘连蛋白, VEGF 和 CTGF 的肝脏蛋白质水平。</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
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。本品罗非考昔 Rofecoxib 是一种有效的, 可口服的 COX-2 特异性抑制剂, 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		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)

激酶实验	<p>体外重组人 COX-1 和 COX-2 生物化学和药理学抑制研究试验: 重组人 COX-1 和 COX-2 的微粒体制剂从牛痘病毒-COS-7 细胞表达系统制备。重组人 COX-1 和 COX-2 在杆状病毒-Sf9 细胞中表达, 并将酶纯化。酶活性通过荧光检测测量还原剂共底物高香草酸氧化型的表型或氧消耗监测。HPLC 试验, 用于评估 0.1 μM 花生四烯酸底物浓度下 Rofecoxib 对纯化 COX-1 的抑制, COX-2 和 Rofecoxib 复合物化学计量的测定, 酶抑制剂复合物在酶活性恢复后的解离速率常数, 完整 Rofecoxib 从复合物中的恢复均如上进行。Rofecoxib HPLC 分析的溶剂体系为 15:85 MeOH/磷酸钾水溶液(1 g/L), 以 15%-75% MeOH 线性梯度洗脱 25 分钟, 在 Novapak C18 柱上以 275 nm 检测。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 人骨肉瘤细胞系和人淋巴瘤 U937 细胞 Concentrations: 0.5 μM, 8 μM Incubation Time: 15 分钟 Method: 通过反转录-聚合酶链反应和免疫印迹, 人骨肉瘤细胞系能够选择性表达 COX-2, 而未分化的人淋巴瘤 U937 细胞选择性表达 COX-1。花生四烯酸刺激后, 这些细胞的 PGE2 产物分别用作 COX-2 和 COX-1 活性的指标。Rofecoxib 与细胞在无血清条件下[Hanks 平衡盐溶液 (HBSS)]预培养 5 带 15 分钟, 然后用 10 μM 花生四烯酸刺激 10 分钟, 再测量 PGE2 的产生。每个细胞系中的 COX 活性根据花生四烯酸存在或不存在下样品中 PGE2 浓度的差别定义。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 大鼠佐剂性关节炎(AIA)模型 Formulation: 80% PEG 200 在蒸馏水中 Dosages: 0.1 mg/kg/day, 0.3 mg/kg/day, 1.0 mg/kg/day, 以及 3.0 mg/kg/day</p>

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。