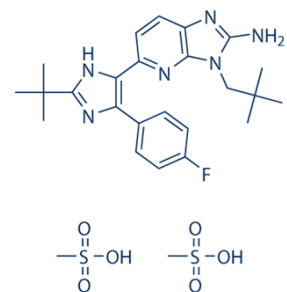


LY2228820

产品编号: MB8816
质量标准: >98%,BR
包装规格: 5MG;25MG
产品形式: solid

基本信息

| | | | |
|----------|--|-------------|---|
| 分子式 | C24H29FN6.2CH4O3S | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 612.74 | | |
| CAS No. | 862507-23-1 | | |
| 储存条件 | -20℃, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性(25℃) | DMSO: 4 mg/mL warmed (6.52 mM) Water: 100 mg/mL warmed (163.2 mM) Ethanol: 3 mg/mL (4.89 mM) | | |
| 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: Ralimetinib dimesylate (LY2228820) 是一种选择性, ATP 竞争性的 p38 MAPK 抑制剂。

别名: LY2228820; LY2228820 dimesylate; 3H-Imidazo[4,5-b]pyridin-2-amine,

5-[2-(1,1-dimethylethyl)-4-(4-fluorophenyl)-1H-imidazol-5-yl]-3-(2,2-dimethylpropyl)-, methanesulfonate (1:2)

物理性状及指标:

外观:白色至黄色固体

溶解性:DMSO: 4 mg/mL warmed (6.52 mM); Water: 100 mg/mL warmed (163.2 mM);

Ethanol: 3 mg/mL (4.89 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | |
|------|---|
| 产品描述 | Ralimetinib (LY2228820) 是一种新型有效的 p38 MAPK 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 7 nM, 不改变 p38 MAPK 的活化。 |
| 特性 | LY2228820 是新型有效的 p38 有丝分裂原活化蛋白激酶(MAPK)通路抑制剂。 |
| 靶点 | p38α (Cell-free assay) 7 nM |
| 体外研究 | LY2228820 作用于 RAW 264.7 细胞, 抑制 p38α,和磷酸 MAPKAPK-2(pMK2)水平,IC50 分别为 7 nM 和 34.3 nM。而且, LY2228820 作用于小鼠腹腔巨噬细胞, 抑制脂多糖 (LPS)-诱导的 TNFα 形成, IC50 为 5.2 nM。200 nM-800 nM LY2228820 作用于多发性骨髓瘤(MM)细胞, 包括 INA6, RPMI-8226, U266, 和 RPMI-Dox40,通过抑制 HSP27 磷酸化而显著抑制 p38MAPK 信号, HSP27 |

| | |
|------|---|
| | 是 p38MAPK 下游靶点,不影响 HSP27 表达水平。200 nM-400 nM LY2228820 增强 Bortezomib 诱导的细胞毒性和凋亡,但是 LY2228820 单独处理不会抑制 MM.1S 细胞生长。200 nM-800 nM LY2228820 作用于长期骨髓基质干细胞(LT-BMSCs), 骨髓单个核细胞(BMMNCs), 外周血 (PB) CD138 ⁺ , CD138 ⁻ 或外周血 (PB) CD14 ⁺ 细胞,也抑制 IL-6 和 MIP-1 α 分泌。400 nM-800 nM LY2228820 也抑制 CD14 ⁺ 细胞形成破骨细胞。 |
| 体内研究 | LY2228820 作用于 LPS 诱导的小鼠,有效抑制 TNF α 形成,半数有效剂量最小阈值 (TMED 50) 小于 1 mg/kg。LY2228820 作用于患胶原性关节炎(CIA)大鼠模型,有效作用于足肿胀,骨质糜烂,和软骨破坏,半数有效剂量最小阈值(TMED50)为 1.5 mg/kg。 |

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)

| | |
|--------|-----------------|
| MB4073 | SB202190 (FHPI) |
| MB5062 | SB203580 |
| MB4047 | TAK-715 |

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 Ralimetinib dimesylate (LY2228820) 是一种选择性,ATP 竞争性的 p38 MAPK 抑制剂,可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体质量 浓度 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|-----------|-----------|-----------|------------|
| 1 mM | 1.6320 mL | 8.1601 mL | 16.3201 mL |
| 5 mM | 0.3264 mL | 1.6320 mL | 3.2640 mL |
| 10 mM | 0.1632 mL | 0.8160 mL | 1.6320 mL |
| 50 mM | 0.0326 mL | 0.1632 mL | 0.3264 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|------|---|
| 激酶实验 | 抑制 p38 α 实验: 使用重组人 p38 α 在标准过滤器中使用 ATP[γ -33P] 和 EGFR 21 肽底物测定抑制 p38 α 的效果。在 LY2228820 存在时,使用 LPS 刺激,在小鼠腹腔巨噬细胞测定抑制 TNF α 效果。在使用 LY2228820 处理,然后用 Anisomycin 刺激的 RAW 264.7 细胞中测定 p38 α 活性。使用磷酸 MAPKAPK-2(pMK2)(Thr 334)抗体测定 p38 α 活性水平。 |
| 细胞实验 | Cell lines: MM 细胞,包括 INA6, RPMI-8226, U266,和 RPMI-Dox40 Concentrations: 200 nM-800 nM Incubation Time: 48 小时 Method: 进行 MTT 实验和 APO 2.7 染色分别测定细胞增殖和凋亡诱导。测定活细胞百分数作为可活力。通过 APO 2.7 染色测定凋亡。为了测定凋亡细胞中线粒体膜蛋白 7A6 的表达,用 APO 2.7 试剂处理细胞 20 分钟。使用 EPICS XL 流式细胞仪测定 APO 2.7 的表达。 |
| 动物实验 | Animal Models: 脂多糖(LPS)-诱导的 Balb/c 小鼠 Formulation: 溶于 1% CMC/溶于水的 0.25% Tween-80 |

| | |
|--|---|
| | <p>Dosages: 0-20 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理，每天两次，持续 14 天</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。