

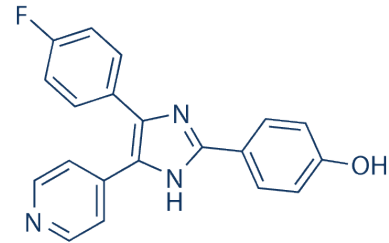
## SB202190 (p38 MAPK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0380-10mM	SB202190 (p38 MAPK 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0380-5mg	SB202190 (p38 MAPK 抑制剂)	5mg
SC0380-25mg	SB202190 (p38 MAPK 抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-[4-(4-fluorophenyl)-5-pyridin-4-yl-1,3-dihydroimidazol-2-ylidene]cyclohexa-2,5-dien-1-one
简称	SB202190
别名	SB 202190; SB-202190; 4-(4-fluorophenyl)-2-(4-hydroxyphenyl)-5-(4-pyridyl)imidazole
中文名	—
化学式	C <sub>20</sub> H <sub>14</sub> N <sub>3</sub> OF
分子量	331.34
CAS号	152121-30-7
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 66mg/ml; Ethanol 12mg/ml
溶液配制	5mg加入1.51ml DMSO, 或者每3.31mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0380-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	SB202190 (FHPI)是一种有效的p38 MAPK抑制剂, 靶向作用于p38α/β, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为50nM/100nM, 有时用于代替SB 203580调查其在体内对SAPK2a/p38的潜在作用。				
信号通路	p38 MAPK Signaling				
靶点	p38α	p38β	—	—	—
IC <sub>50</sub>	50nM	100nM	—	—	—
体外研究	SB 202190显著抑制内源本底和抗Fas抗体诱导的MAPK活性, 且抑制效果呈剂量依赖性。SB 202190本身就足以诱导Jurkat细胞和Hela细胞的死亡: 通过激活CPP 32样半胱氨酸蛋白酶, 可阻断Bcl-2的表达。p38β可减轻而p38α可加剧由SB 202190诱导的细胞凋亡。在HaCaT细胞中SB 202190强烈抑制由紫外线诱导的cox-2蛋白表达和mRNA水平。用SB 202190处理肾小管上皮细胞(正常大鼠肝脏-52E), 可将由白蛋白引发的炎症(单核细胞趋化蛋白-1, MCP-1或肿瘤生长因子β-1(TGFβ-1)引发的原纤维化(原骨胶原I α1, procollagen-I α1)相关基因降低50%。SB 202190处理A549细胞, 可诱导JNK磷酸化(该磷酸化效应呈时间和剂量依赖性)、转录因子ATF-2磷酸化, 并增加AP-1与DNA的结合。SB 202190处理促进THP-1和MV4-11细胞的生长。SB 202190可提高c-Raf和ERK(细胞外信号调节激酶)磷酸化, 暗示由SB 202190诱导的白血病细胞增殖过程有Ras-Raf-MEK-mitogen激活的MAPK通路的参与。				
体内研究	SB 202190通过抑制p38减弱了由人脊髓灰质炎IgG(PV-IgG)在被动转移小鼠模型中诱发的水泡形成。在脓毒症内毒素模型中, 与对照组相比, 经SB 202190处理可显著提高存活率。				
临床实验	N/A				
特征	SB 202190与SB 203580极为相似。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	p38α和p38β溶解在25mM的Tris-HCl缓冲液中, PH 7.5, 含0.1mM EGTA, 髓鞘碱性蛋白(0.33毫克/毫升)作为底物。人工操作条件用50μl [γ- <sup>33</sup> P]ATP于30°C孵育10分钟; Biomek 2000自动化工作站用25μl [γ- <sup>33</sup> P]ATP

	在96孔板室温孵育40分钟。ATP和乙酸镁浓度分别为0.1mM和10mM。所有检测都用MgATP起始。人工检测将孵育液滴到磷酸纤维素纸上，浸泡在50mM磷酸中。用5μl磷酸终止反应，后将孵育液点滴在P30过滤垫上。滤膜在50mM磷酸中漂洗四次以去除ATP，在用丙酮(人工孵育)或甲醇(工作站孵育)处理后，干燥并用放射性计量。
--	--

细胞实验	
细胞系	Jurkat和HeLa细胞
浓度	溶解于DMSO，终浓度~50μM
处理时间	24小时
方法	细胞血清饥饿后，用不同浓度SB 202190处理24小时。用台盼蓝或PI染色后经流式细胞仪分析，以检测细胞活力。凋亡细胞核用H33258染色。

动物实验	
动物模型	C57BL/6J小鼠皮内注射无菌的对照IgG或人脊髓灰质炎IgG做对比
配制	DMSO溶解，生理盐水稀释
剂量	12.5μg
给药方式	皮内注射

### 参考文献：

1. Davies SP, et al. Biochem J, 2000, 351(Pt 1), 95-105.
2. Nemoto S, et al. J Biol Chem, 1998, 273(26), 16415-16420.
3. Chen W, et al. Oncogene, 2001, 20(29), 3921-3926.
4. Prakash J, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2006, 319(1), 8-19.
5. Berkowitz P, et al. Proc Natl Acad Sci U S A, 2006, 103(34), 12855-12860.
6. Muniyappa H, et al. Cell Signal, 2008, 20(4), 675-683.
7. Hirosawa M, et al. Leuk Res, 2009, 33(5), 693-699.
8. O'Sullivan AW, et al. J Surg Res, 2009, 152(1), 46-53.
9. Paillas S, et al. Cancer Res, 2011, 71(3), 1041-1049.
10. Tsai MS, et al. Mol Cancer Ther, 2012, 11(3), 561-571.

### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0380-10mM	SB202190 (p38 MAPK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0380-5mg	SB202190 (p38 MAPK抑制剂)	5mg
SC0380-25mg	SB202190 (p38 MAPK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

### 保存条件：

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

### 注意事项：

- 本产品可能对人体有一定的毒害作用，请注意适当防护，以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

### 使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：  
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.06.04