



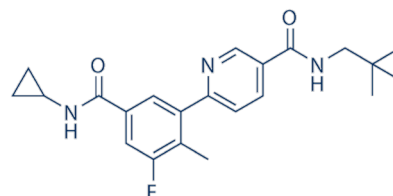
Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD5987-10mM	Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5987-5mg	Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)	5mg
SD5987-25mg	Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-[5-(cyclopropylcarbamoyl)-3-fluoro-2-methylphenyl]-N-(2,2-dimethylpropyl)pyridine-3-carboxamide
简称	Losmapimod
别名	GW856553, GSK-AHAB, GE-0056, GW 856553, GW-856553
中文名	N/A
化学式	C ₂₂ H ₂₆ FN ₃ O ₂
分子量	383.46
CAS号	585543-15-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 76mg/ml; Ethanol 41mg/ml warming
溶液配制	5mg加入1.30ml DMSO, 或每3.83mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD5987-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Losmapimod是口服有效的选择性p38 MAPK抑制剂, 其作用于p38α和p38β的pKi分别为8.1和7.6。 Phase 3。				
信号通路	MAPK				
靶点	p38α	p38β	—	—	—
IC50	8.1(pKi)	7.6(pKi)	—	—	—
体外研究	N/A				
体内研究	在自发性高血压易卒型大鼠(SHR-SP)体内, Losmapimod显著提高存活率, 内皮细胞依赖性和非依赖性血管舒张作用, 以及肾功能指数, 随后减弱血脂异常, 高血压, 心脏重塑, 血浆肾素活性(PRA), 醛固酮, 以及白细胞介素-1β(IL-1β)。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	对p38α和p38β的抑制通过使用配体取代荧光偏振试验来确定。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	自发性高血压易卒型大鼠
配制	N/A
剂量	~12毫克/千克

给药方式	口服
------	----

➤ **参考文献:**

1. Willette RN, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2009, 330(3), 964-970.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD5987-10mM	Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5987-5mg	Losmapimod (p38 MAPK抑制剂)	5mg
SD5987-25mg	Losmapimod (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包装也可以室温保存，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个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，并注意有效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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01