



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **SKF-86002**  
CAS 号: **72873-74-6**  
产品货号: **S86339**

### 生物活性:

|                                                                   |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
|-------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------|-----------|------------|------------|-------|
| Description                                                       | SKF-86002 是一种具有口服活性的 p38 MAPK 抑制剂, 具有抗炎、抗关节炎活性, 可用于缓解疼痛的研究。SKF-86002 抑制脂多糖 (LPS) 刺激人单核细胞产生 IL-1 和 TNF- $\alpha$ (IC50 = 1 $\mu$ M)。SKF-86002 能抑制脂氧合酶和环氧合酶介导的花生四烯酸代谢。 |                                                                      |           |            |            |       |
| In Vitro                                                          | SKF-86002 (10 $\mu$ M; 1 小时) 抑制紫外线照射 (UV) 应激刺激诱导的细胞凋亡[1]。                                                                                                            |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | SKF-86002 不抑制未分化 HL 中紫外线诱导的细胞凋亡-60 细胞[1]。                                                                                                                            |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | SKF-86002 (10 $\mu$ M; 72 小时) 阻止 IL-4 诱导的单核细胞或 U937 细胞 CD23 表面表达和蛋白质形成, 对 CD23 mRNA 没有影响级别[4]。                                                                       |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | Western Blot Analysis[4]                                                                                                                                             |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | Cell Line:                                                                                                                                                           | U937 cells                                                           |           |            |            |       |
|                                                                   | Concentration:                                                                                                                                                       | 10 $\mu$ M                                                           |           |            |            |       |
| In Vivo                                                           | Incubation Time:                                                                                                                                                     | 72 hours                                                             |           |            |            |       |
|                                                                   | Result:                                                                                                                                                              | Significantly reduced CD23 levels on IL-4-treated U937 cells.        |           |            |            |       |
|                                                                   | SKF-86002 (10-90 mg/kg; 口服; 每日一次; 持续 22 天) 具有抗关节炎活性[5]。                                                                                                              |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | Animal Model:                                                                                                                                                        | Lewis rats, with adjuvant-induced arthritis (AA)[5]                  |           |            |            |       |
|                                                                   | Dosage:                                                                                                                                                              | 10 mg/kg, 30 mg/kg, 90 mg/kg                                         |           |            |            |       |
| In Vivo                                                           | Administration:                                                                                                                                                      | Oral administration, daily, for 22 days                              |           |            |            |       |
|                                                                   | Result:                                                                                                                                                              | Significantly decreased hindleg volumes after injection of adjuvant. |           |            |            |       |
|                                                                   | 细胞实验:                                                                                                                                                                |                                                                      |           |            |            |       |
| Solvent&Solubility                                                | DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (112.09 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | Preparing Stock Solutions                                                                                                                                            | Solvent                                                              | Mass      | 1 mg       | 5 mg       | 10 mg |
|                                                                   |                                                                                                                                                                      | Concentration                                                        |           |            |            |       |
|                                                                   |                                                                                                                                                                      | 1 mM                                                                 | 3.3630 mL | 16.8152 mL | 33.6304 mL |       |
|                                                                   |                                                                                                                                                                      | 5 mM                                                                 | 0.6726 mL | 3.3630 mL  | 6.7261 mL  |       |
|                                                                   | 10 mM                                                                                                                                                                | 0.3363 mL                                                            | 1.6815 mL | 3.3630 mL  |            |       |
|                                                                   | *请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。                                                                                                          |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。                                                                               |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | 动物实验:                                                                                                                                                                |                                                                      |           |            |            |       |
|                                                                   | 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。                                                                                                                                            |                                                                      |           |            |            |       |
| 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂:                        |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
| ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用;     |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
| 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
| 方案 一                                                              |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |
| 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- $\beta$ -CD in Saline)        |                                                                                                                                                                      |                                                                      |           |            |            |       |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (8.41 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 20% 的 SBE-<math>\beta</math>-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>2 g SBE-<math>\beta</math>-CD (磺丁基醚 <math>\beta</math>-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。</p> <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO <math>\rightarrow</math> 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (8.41 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中, 混合均匀。</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| 参考文献 | <p>[1]. Frasch SC, et al. p38 mitogen-activated protein kinase-dependent and -independent intracellular signal transduction pathways leading to apoptosis in human neutrophils. J Biol Chem. 1998 Apr 3;273(14):8389-97.</p> <p>[2]. Griswold DE, et al. SK&amp;F 86002: a structurally novel anti-inflammatory agent that inhibits lipoxygenase- and cyclooxygenase-mediated metabolism of arachidonic acid. Biochem Pharmacol. 1987 Oct 15;36(20):3463-70.</p> <p>[3]. Lee JC, et al. A protein kinase involved in the regulation of inflammatory cytokine biosynthesis. Nature. 1994;372(6508):739-746.</p> <p>[4]. L A Marshall, et al. Inhibitors of the p38 mitogen-activated kinase modulate IL-4 induction of low affinity IgE receptor (CD23) in human monocytes. J Immunol. 1998 Dec 1;161(11):6005-13.</p> <p>[5]. M J DiMartino, et al. Pharmacologic characterization of the antiinflammatory properties of a new dual inhibitor of lipoxygenase and cyclooxygenase. Agents Actions. 1987 Feb;20(1-2):113-23.</p> |

#### 完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year. -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

| 可选溶剂 | 质量<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 3.3630 mL | 16.8152 mL | 33.6304 mL | 84.0760 mL |
|      | 5 mM             | 0.6726 mL | 3.3630 mL  | 6.7261 mL  | 16.8152 mL |
|      | 10 mM            | 0.3363 mL | 1.6815 mL  | 3.3630 mL  | 8.4076 mL  |
|      | 15 mM            | 0.2242 mL | 1.1210 mL  | 2.2420 mL  | 5.6051 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1682 mL | 0.8408 mL  | 1.6815 mL  | 4.2038 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1345 mL | 0.6726 mL  | 1.3452 mL  | 3.3630 mL  |
|      | 30 mM            | 0.1121 mL | 0.5605 mL  | 1.1210 mL  | 2.8025 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0841 mL | 0.4204 mL  | 0.8408 mL  | 2.1019 mL  |



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyysw@sina.com

|  |               |           |           |           |           |
|--|---------------|-----------|-----------|-----------|-----------|
|  | <b>50 mM</b>  | 0.0673 mL | 0.3363 mL | 0.6726 mL | 1.6815 mL |
|  | <b>60 mM</b>  | 0.0561 mL | 0.2803 mL | 0.5605 mL | 1.4013 mL |
|  | <b>80 mM</b>  | 0.0420 mL | 0.2102 mL | 0.4204 mL | 1.0510 mL |
|  | <b>100 mM</b> | 0.0336 mL | 0.1682 mL | 0.3363 mL | 0.8408 mL |



源叶