



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
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **R-7050**
CAS 号: **303997-35-5**
产品货号: **S88641**

生物活性:				
Description	R-7050 (TNF- α Antagonist III) 是一种肿瘤坏死因子受体 (TNFR) 拮抗剂, 对 TNF α 具有更高选择性。			
IC50 & Target[1]	CD40			
In Vitro	R-7050 (TNF-α 拮抗剂 III) 是一种有效且完全可逆的命中物, 对 TNFα 具有更高的选择性。在 TNFα 诱导的细胞间粘附分子 1 (ICAM-1) 表达中, R-7050 抑制效力 (EC50=0.63 μM) 比用 IL-1β 诱导的 ICAM-1 表达的 EC50 高 2 至 3 倍 (EC50=1.45 2 μM)。R-7050 抑制 JNK 通路 (MKK4、JNKs 和 ATF2) 和 p38 通路 (MKK3/6、p38 和 MAPKAP2) 的磷酸化[1]。 R-7050 是一种细胞渗透性三唑并喹啉化合物, 可选择性抑制 TNF-α 诱导的细胞信号传导。与直接结合 TNF-α 并充当诱饵受体的生物 TNF 抑制剂 (例如 Infliximab, Etanercept, Adalimumab) 不同, R-7050 不影响 TNF-α 与 TNFR 的结合。相反, R-7050 选择性地抑制 TNFR 与细胞内衔接分子 (例如 TRADD、RIP) 的结合, 限制受体内化, 并阻止 TNF-α 结合后的后续细胞反应[2]。			
In Vivo	R-7050 (TNF-α 拮抗剂 III) (6 mg/kg) 在 ICH 后 0.5 小时或 2 小时给药时, 脑组织伊文思蓝外渗量分别为 28.7$\pm$5.9 μg 和 30.3$\pm$1.9 μg (与 ICH 相比 p<0.05 和 p<0.01; 与假手术没有显著差异)。ICH 后 24 小时, 脑含水量 (脑水肿的量度) 从假手术小鼠的 75.6$\pm$0.3% 增加到 81.5$\pm$0.5% (与假手术相比 p<0.05)。6、12 或 18 mg/kg R-7050 分别将脑含水量降低至 78.5$\pm$0.3%、78.3$\pm$0.3% 或 79.3$\pm$0.5% (所有处理与 ICH 相比 p<0.05; 处理之间没有显著差异)。值得注意的是, 用 18 mg/kg 处理的小鼠表现出一般活动/运动的减少。正如伊文思蓝外渗所观察到的, R-7050 (6 mg/kg) 显著降低 ICH 后的脑含水量。在 ICH 后 0.5 小时或 2 小时施用 R-7050 可将脑含水量降低至在假手术小鼠中观察到的水平 (与 ICH 相比, p<0.05, 与假手术无显著差异)[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (65.66 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 Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.6263 mL	13.1313 mL
		5 mM	0.5253 mL	2.6263 mL
		10 mM	0.2626 mL	1.3131 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline			



	Solubility: 2.5 mg/mL (6.57 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Gururaja TL, et al. A class of small molecules that inhibit TNFα-induced survival and death pathways via prevention of interactions between TNFαRI, TRADD, and RIP1. Chem Biol. 2007 Oct;14(10):1105-18. [2]. King MD, et al. TNF-α receptor antagonist, R-7050, improves neurological outcomes following intracerebral hemorrhage in mice. Neurosci Lett. 2013 May 10;542:92-6.

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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.6263 mL	13.1313 mL	26.2626 mL	65.6564 mL
	5 mM	0.5253 mL	2.6263 mL	5.2525 mL	13.1313 mL
	10 mM	0.2626 mL	1.3131 mL	2.6263 mL	6.5656 mL
	15 mM	0.1751 mL	0.8754 mL	1.7508 mL	4.3771 mL
	20 mM	0.1313 mL	0.6566 mL	1.3131 mL	3.2828 mL
	25 mM	0.1051 mL	0.5253 mL	1.0505 mL	2.6263 mL
	30 mM	0.0875 mL	0.4377 mL	0.8754 mL	2.1885 mL
	40 mM	0.0657 mL	0.3283 mL	0.6566 mL	1.6414 mL
	50 mM	0.0525 mL	0.2626 mL	0.5253 mL	1.3131 mL
	60 mM	0.0438 mL	0.2189 mL	0.4377 mL	1.0943 mL