



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: **RWJ-67657**
CAS 号: **215303-72-3**
产品货号: **S89216**

生物活性:								
Description	RWJ-67657 (JNJ 3026582) 是一种具有口服活性的选择性 p38 α 和 p38 β 抑制剂, IC50 分别为 1 和 11 μM。RWJ-67657 对 p38 γ 和 p38 δ 无活性, 是心脏保护剂, 具有抗炎和抗肿瘤活性。							
IC50 & Target[1]	<table><tr><td>p38α</td><td>p38β</td></tr><tr><td>1 μM (IC50)</td><td>11 μM (IC50)</td></tr></table>				p38α	p38β	1 μM (IC50)	11 μM (IC50)
p38α	p38β							
1 μM (IC50)	11 μM (IC50)							
In Vitro	RWJ-67657 inhibits the release of TNF- α by lipopolysaccharide (LPS)-treated human peripheral blood mononuclear cells with an IC50 of 3 nM, as well as the release of TNF- α from peripheral blood mononuclear cells treated with the superantigen staphylococcal enterotoxin B, with an IC50 value of 13 nM[2].							
	RWJ67657 (10 μM; 24 hours) decreases colony formation in MCF-7 cells[3]。							
	Cell Proliferation Assay[3]							
	Cell Line:	MCF-7 breast carcinoma cells						
	Concentration:	10 μM						
	Incubation Time:	24 hours						
In Vivo	Result:	Decreased colony formation.						
	RWJ-67657 inhibits TNF-alpha production in lipopolysaccharide-injected mice (87% inhibition at 50 mg/kg) and in rats (91% inhibition at 25 mg/kg) after oral administration[2].							
	RWJ-67657 (50 mg/kg; administered orally; once per day for 7 consecutive days) displays a potent anti-inflammatory effect. By both improving the functioning of endothelial progenitor cells (EPCs) and reducing inflammation, EPC transplantation plus RWJ-67657 administration synergistically promotes angiogenesis and neurogenesis after diabetic stroke[4].							
	Animal Model:	The db/db mice (male, 8 weeks old) with EPCs[4]						
	Dosage:	50 mg/kg						
	Administration:	Administered orally; once per day for 7 consecutive days						
Solvent&Solubility	Result:	Increased angiogenesis and neurogenesis of diabetic mice after cotreatment with EPCs transplantation.						
	细胞实验:							
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (293.77 mM; 超声助溶 (<60° C); 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	10 mg			
		1 mM	2.3502 mL	11.7509 mL	23.5018 mL			
		5 mM	0.4700 mL	2.3502 mL	4.7004 mL			
10 mM		0.2350 mL	1.1751 mL	2.3502 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。								
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: ≥ 2.08 mg/mL (4.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.89 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Shahin R, et al. Research advances in kinase enzymes and inhibitors for cardiovascular disease treatment. Future Sci OA. 2017 Aug 8;3(4):FSO204. [2]. Wadsworth SA, et al. RWJ 67657, a potent, orally active inhibitor of p38 mitogen-activated protein kinase. J Pharmacol Exp Ther. 1999 Nov;291(2):680-7. [3]. Frigo DE, et al. p38 mitogen-activated protein kinase stimulates estrogen-mediated transcription and proliferation through the phosphorylation and potentiation of the p160 coactivator glucocorticoid receptor-interacting protein 1. Mol Endocrinol. 2006 Ma [4]. Bai YY, et al. Synergistic Effects of Transplanted Endothelial Progenitor Cells and RWJ 67657 in Diabetic Ischemic Stroke Models. Stroke. 2015 Jul;46(7):1938-46.
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, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3502 mL	11.7509 mL	23.5018 mL	58.7544 mL
	5 mM	0.4700 mL	2.3502 mL	4.7004 mL	11.7509 mL
	10 mM	0.2350 mL	1.1751 mL	2.3502 mL	5.8754 mL
	15 mM	0.1567 mL	0.7834 mL	1.5668 mL	3.9170 mL
	20 mM	0.1175 mL	0.5875 mL	1.1751 mL	2.9377 mL
	25 mM	0.0940 mL	0.4700 mL	0.9401 mL	2.3502 mL
	30 mM	0.0783 mL	0.3917 mL	0.7834 mL	1.9585 mL
	40 mM	0.0588 mL	0.2938 mL	0.5875 mL	1.4689 mL
	50 mM	0.0470 mL	0.2350 mL	0.4700 mL	1.1751 mL
	60 mM	0.0392 mL	0.1958 mL	0.3917 mL	0.9792 mL
	80 mM	0.0294 mL	0.1469 mL	0.2938 mL	0.7344 mL
	100 mM	0.0235 mL	0.1175 mL	0.2350 mL	0.5875 mL

源叶