



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](mailto:shyysw@sina.com)

产品名称: **R1487 (Hydrochloride)**

产品别名: **R1487 Hydrochloride**

| 生物活性:              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                               |           |            |
|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|-----------|------------|
| Description        | R1487 (Hydrochloride) is highly potent and highly selective inhibitors of p38 $\alpha$ . target: p38 $\alpha$ ; R1487 (Hydrochloride) potently inhibits cytokine production in a variety of in vitro and in vivo models.[1] R1487 (Hydrochloride) inhibits production of TNFR by human monocytic cells (THP-1) and inhibits production of IL-1 $\beta$ in human whole blood (HWP) induced by LPS.[1] |                               |           |            |
| Solvent&Solubility | <b>In Vitro:</b><br>DMSO : 20.83 mg/mL (49.03 mM; Need ultrasonic)<br>H <sub>2</sub> O : < 0.1 mg/mL (insoluble)                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                               |           |            |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | Solvent Mass<br>Concentration | 1 mg      | 5 mg       |
|                    | Preparing                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 1 mM                          | 2.3539 mL | 11.7694 mL |
|                    | Stock Solutions                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | 5 mM                          | 0.4708 mL | 2.3539 mL  |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | 10 mM                         | 0.2354 mL | 1.1769 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。<br>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。                                                                                                                                                                                                                                                |                               |           |            |
|                    | <b>In Vivo:</b><br>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:<br>——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                                                                                                                                                                                      |                               |           |            |
|                    | 1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline<br>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.90 mM); Clear solution<br>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.90 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例,取 100 $\mu$ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中,混合均匀向上述体系中加入 50 $\mu$ L Tween-80,混合均匀;然后继续加入 450 $\mu$ L 生理盐水定容至 1 mL。                                                                                  |                               |           |            |
|                    | 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil<br>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.90 mM); Clear solution<br>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.90 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液,此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。<br>以 1 mL 工作液为例,取 100 $\mu$ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 $\mu$ L 玉米油中,混合均匀。                                                                                                                                                         |                               |           |            |
|                    | [1]. Goldstein DM et al. Discovery of<br>6-(2,4-difluorophenoxy)-2-[3-hydroxy-1-(2-hydroxyethyl)propylamino]-8-methyl-8H-pyrido[2,3-d]pyrimidin-7                                                                                                                                                                                                                                                    |                               |           |            |



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](mailto:shyysw@sina.com)

#### References

-one (pamapimod) and  
6-(2,4-difluorophenoxy)-8-methyl-2-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrido[2,3-d]pyrimidin-7(8H)-one  
(R1487) as orally bioavailable and highly selective inhibitors of p38 $\alpha$  mitogen-activated protein kinase. J  
Med Chem. 2011 Apr 14;54(7):2255-65.



源叶生物