

TM5441 ; TM-5441

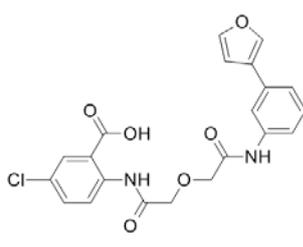
产品编号：MB0593

质量标准：>98%

包装规格：2MG；10MG

产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₁₇ ClN ₂ O ₆	结 构 式 
分子量	428.82	
CAS No.	1190221-43-2	
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥	
溶解性 (25℃)	DMSO: ≥300 mg/mL	
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。	
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。	

简介：TM5441 是纤溶酶原激活物抑制剂-1 (PAI-1); 抑制多个肿瘤细胞系的 IC₅₀ 值在 9.7 至 60.3 μM 之间。

别名：Benzoic acid, 5-chloro-2-[[2-[2-[[3-(3-furanyl)phenyl]amino]-2-oxoethoxy]acetyl]amino]

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO: ≥300 mg/mL

纯度：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

糖尿病肾病是全世界末期肾病的主要原因，但没有有效的治疗策略。因为纤溶酶原激活物抑制剂-1 (PAI-1) 越来越被认为是糖尿病肾病中细胞外基质 (ECM) 蓄积的关键因子，研究检查了两种新型口服活性 PAI-1 抑制剂 TM5275 和 **TM5441** 的肾保护作用在链脲佐菌素 (STZ) 诱导的糖尿病小鼠中不引发出血事件。向 STZ 诱导的糖尿病和年龄匹配的对照小鼠口服施用 TM5275 (50mg / kg) 和 TM5441 (10mg / kg) 16 周。相对于对照小鼠，糖尿病小鼠显示显著增加 (p < 0.05) 血浆葡萄糖和肌酐水平，尿白蛋白排泄，肾与体重比，肾小球体积和系膜面积分数。在糖尿病小鼠的肾脏中，纤维化和炎症以及 PAI-1 的标志物也上调，并且用 TM5275 和 **TM5441** 的治疗有效地抑制了糖尿病肾脏中的蛋白尿，系膜扩张，ECM 积聚和巨噬细胞浸润。此外，在小鼠近端肾小管上皮 (mProx24) 细胞中，TM5275 和 **TM5441** 均有效抑制 PAI-1 诱导的纤维化和炎症标志物的 mRNA 表达，并且还逆转了 PAI-1 诱导的纤溶酶活性的抑制，这证实了 TM 化合物作为 PAI-1 抑制剂。这些数据表明 TM 化合物可用于预防糖尿病肾损伤。

产品描述	TM5441 是纤溶酶原激活物抑制剂-1 (PAI-1); 抑制多个肿瘤细胞系的 IC ₅₀ 值在 9.7 至 60.3 μM 之间。
靶点&IC50	IC50: 9.7 and 60.3 μM (Tumor cell lines)
体外研究	TM5441 剂量依赖性地降低 HT1080、HCT116、Daoy、MDA-MB-231 和 Jurkat 细胞, IC50 介于 9.7 和 60.3 μm 之间。TM544 1 部分通过减少增殖而降低肿瘤细胞活力。TM5441 以剂量依赖的方式增加 HT1080 和 HCT116 细胞的半胱氨酸天冬氨酸蛋白酶 3/7 活性。TM5441 是肿瘤细胞内在凋亡的有力刺激因子。TM5441 诱导线粒体去极化。在小鼠近端肾小管上皮细胞中, TM5441 有效地抑制 PAI-1 诱导的纤维化和炎症标志物的 mRNA 表达, 也逆转 PAI-1 诱导的纤溶酶活性的抑制。
体内研究	向 HT1080 和 HCT116 异种移植小鼠口服 TM5441 (20mg / kg 每日) 增加肿瘤细胞凋亡并对肿瘤血管系统具有显著的破坏作用, 其与肿瘤生长的减少和存活增加相关。口服给药后 1 小时的平均峰血浆浓度为 11.4 μM, 给药后 23 小时检测不到的水平。 TM5441 有效抑制糖尿病肾脏中的蛋白尿, 系膜扩张, ECM 积聚和巨噬细胞浸润。

美仑相关产品推荐

MB0594	TM5275 sodium
MB1780	SR12813
MB0264	SR3677
MB0592	G3335 ; H-Trp-Glu-OH
MB5023	2-氯-5-硝基苯甲酰胺;GW 9662
MB3813	GSK3787
MB3709	GW0742
MB7303	GW501516
MB4844	L-165041
MB3812	T0070907

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。TM5441 是纤溶酶原激活物抑制剂-1 (PAI-1), TM 化合物可用于预防糖尿病肾损伤。

储液配置

浓度	质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3320 mL	11.6599 mL	23.3198 mL
5 mM	0.4664 mL	2.3320 mL	4.6640 mL
10 mM	0.2332 mL	1.1660 mL	2.3320 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	TM544 1 在 50 mM 的浓度下用 DMSO 溶解。 用 MTT 法测定 HT1080、HCT116、Daoy、MDA-MB-231 和 Jurkat 细胞在 37°C 0 ~ 100 μm
-------------	--

	TM544 1 处理 48 小时的细胞活力。
动物实验	TM5441 在 0.5% 羧甲基纤维素中制备。 小鼠：在对照和糖尿病小鼠中口服给药 50mg / kg / 天的 TM5275 和 10mg / kg / 天的 TM5441 16 周。 小鼠每天至少监测一次。 最后，收集血液用于测量血浆葡萄糖和肌酸酐，尿液用于蛋白质测量，肾脏用于免疫组织化学分析。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M ²)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
> 1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。