

## TM5275 sodium

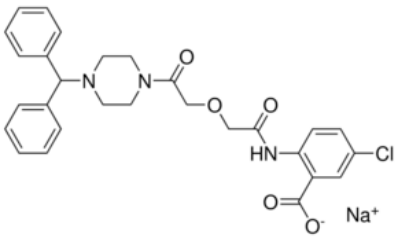
产品编号：MB0594

质量标准：&gt;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 <sub>28</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>5</sub> · Na	结 构 式	
分子量	543.97		
CAS No.	1103926-82-4		
储存条件	2-8°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 10 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：**TM5275 sodium 是纤溶酶原激活物抑制剂 (PAI-1)，IC<sub>50</sub>值为 6.95 μM。

**别名：**Benzoic acid, 5-chloro-2-[[2-[2-[4-(diphenylmethyl)-1-piperazinyl]-2-oxoethoxy]acetyl]amino]-, sodium salt (1:1)

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO: 10 mg/ml

纯度：.....&gt;98%

**储存条件：**2-8°C，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) 血浆葡萄糖和肌酸酐水平，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。

<b>产品描述</b>	TM5275 sodium 是纤溶酶原激活物抑制剂 (PAI-1)，IC <sub>50</sub> 值为 6.95 μM。
<b>靶点&amp;IC50</b>	IC <sub>50</sub> : 6.95 μM (PAI-1)

<b>体外研究</b>	对接研究表明, TM5255 与 PAI-1 的 Aβ片 ( S4A ) 位置的链 4 结合。TM5255 是一种选择性 PAI-1 和 ( 最多 100μm ) 不干扰其他 SerpN/丝氨酸蛋白酶系统。TM5255 浓度为 20μm 和 100μm 时, 通过抑制 TPA-GFP - PAI-1 高分子量复合物的形成, 显著延长了 TPA GFP 在 VECs 上的滞留。TM5255 增强了纤溶酶原的时间依赖性积累以及纤维蛋白凝块在 TPA GFP 表达细胞周围的溶解。在 ES-2 和 JHOC-9 细胞中, 72 小时处理的细胞活力随着 70~100μm TM5255 的降低而降低。从 48 小时到 96 小时, 细胞生长受到抑制, 100μm TM5255。与对照组相比, 100μm TM5255 处理的细胞中 PAI-1 活性明显降低。TM5255 在 PAI-1 高表达的卵巢癌中发挥抗增殖作用。
<b>体内研究</b>	TM5255 具有良好的药代动力学特征, 对小鼠和大鼠的毒性非常低。大鼠血栓形成模型。10 和 50 mg/kg TM5255 ( 60.9±3 和 56.8±2.8 mg ) 的大鼠血液凝块重量显著低于对照组 ( 72.5±2 mg )。TM5255( 50 毫克 mg/kg ) 的抗血栓有效性相当于噻氯匹定 ( 500 毫克 mg/kg )。TM5255 浓度为 10 mg/mg/kg 时, 血浆浓度达到 17.5±5.2μm。TM5255 ( 5 mg/mg/kg ) 联合 TPA ( 0.3 mg/mg/kg ) 显著提高 TPA ( 0.3 mg/mg/kg ) 的抗血栓作用, 并与高 TPA 剂量 ( 3 mg/mg/kg ) 相似。

**美仑相关产品推荐**

MB0593	TM5441
MB1780	SR12813
MB0264	SR3677
MB0592	G3335 ; H-Trp-Glu-OH
MB5023	2-氯-5-硝基苯甲酰苯胺;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。TM5275 sodium 是纤溶酶原激活物抑制剂 (**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	1.8349 mL	9.1746 mL	18.3493 mL
5 mM	0.3670 mL	1.8349 mL	3.6699 mL
10 mM	0.1835 mL	0.9175 mL	1.8349 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	TM5255 具有良好的药代动力学特征, 对小鼠和大鼠的毒性非常低。大鼠血栓形成模型。10 和 50 mg/kg TM5255 ( 60.9±3 和 56.8±2.8 mg ) 的大鼠血液凝块重量显著低于对照组 ( 72.5±2 mg )。TM5255( 50 毫克 mg/kg ) 的抗血栓有效性相当于噻氯匹定 ( 500 毫克 mg/kg )。TM5255
-------------	--

	浓度为 10 mg/mg/kg 时，血浆浓度达到 $17.5 \pm 5.2 \mu\text{m}$ 。TM5255 ( 5 毫克 mg/kg ) 与 TPA ( 0.3 mg/mg / kg ) 联合应用可显著提高 TPA ( 0.3 mg/mg/kg ) 的抗血栓作用，并与高 TPA 剂量 ( 3 毫克 mg/kg ) 相比有显著益处
<b>细胞实验</b>	TM5275 在 DMSO 中制备。 ES2 细胞用 DMSO ( 对照 ) 或 100 $\mu\text{M}$ TM5275 处理指定的时间 ( 24,48,72,96 小时 )。通过 CellTiter-Glo 测定来确定细胞生长。
<b>动物实验</b>	TM5255 悬浮于 0.5% 羧甲基纤维素钠盐 ( CMC ) 中。 大鼠：在雄性 CD 大鼠中实现动静脉旁路血栓形成。TM5255 ( 10 和 50 毫克 mg/kg , n = 9 ) 或噻氯匹定 ( 500 毫克 mg/kg , n = 6 ) ，悬浮于 0.5% CMC 溶液中，在研究前口服 90 分钟，口服给药。对照组仅给予 0.5% CMC 溶液 ( n = 10 ) 。血液允许通过分流术循环 30 分钟。最终测量覆盖丝线的血栓的湿重。 小鼠：TM5255 通过灌胃给雄性 ICR 小鼠 ( 50 毫克 mg/kg ) 口服。在口服给药前 ( 0 小时 ) 和 1, 2, 6、24 h 从静脉收集肝素化血液样品。反相高效液相色谱法测定血浆药物浓度

**【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(M2)	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。