

TAPI-1

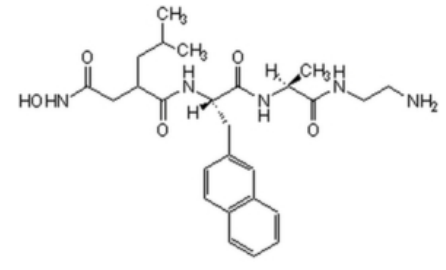
产品编号：MB2814

质量标准：>98%,BR

包装规格：1MG；5MG

产品形式：白色固体

基本信息

分子式	C26H37N5O5	结 构 式	
分子量	499.60		
CAS No.	171235-71-5		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 99 mg/mL (198.15 mM) Ethanol 99 mg/mL (198.15 mM) Water 60 mg/mL warmed (120.09 mM)		
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：TAPI-1 是一种 ADAM17/TACE 抑制剂，其对细胞因子受体有抑制作用。

别名：N-(R)-[2-(Hydroxyaminocarbonyl)methyl]-4-methylpentanoyl-L-naphthylalanyl-L-alanine, 2-aminoethyl Amide, TNF-α Protease Inhibitor-1

物理性状及指标：

外观：.....白色固体

溶解性：.....DMSO 99 mg/mL (198.15 mM) ;Ethanol 99 mg/mL (198.15 mM) ;Water 60 mg/mL warmed (120.09 mM)

纯度：.....>98%,BR

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

阿尔茨海默病的淀粉样前体蛋白 (APP) 是一种跨膜蛋白，在其胞外域中裂解，释放可溶性 N-末端片段 (SAPP-α)。这一过程的推定介质包括亚当 (解体素和金属蛋白酶) 家族三个成员，ADAM9，ADAM10 和 ADAM17/TACE (肿瘤坏死因子-α转化酶)。肿瘤坏死因子-α蛋白酶抑制剂 (TAPI-1)，是 ADAMs 抑制剂，在 HEK-293 细胞中可稳定表达 M3 muscarinic 受体，降低了其本构性和肌红蛋白受体刺激的 sAPP 的释放量。然而，前者对 TAPI-1 (IC₅₀) = 8.09 μm) 比后者 (IC₅₀) = 3.61 微米) 更不敏感，这表明这些过程可能是由不同的金属蛋白酶介导的。在 TACE 瞬时转染的细胞中，组成型 SAPPα 释放增加了几倍，并且这种增加与 TACE 表达成正比。相反，毒蕈碱受体激活的 SAPPα 释放在 TACE 转染剂中没有改变。共转染 APP (695) 的 TACE 依赖性本构释放受 TAPI-1 抑制，IC₅₀ 为 0.92 μm，其值显著低于 IC₅₀ S，以抑制内源性分泌酶介导的本构或受体调节的 SAPPα 脱落。结果表明，TACE 能够催化 APP 的组成型 α 分泌切割，但亚当家族中的额外成员可能介导 SeAP-alpha 在 HEK-293 细胞中的内源性组成和受体偶联释放。

产品描述	TAPI-1 是一种 ADAM17/TACE 抑制剂，其对细胞因子受体有抑制作用。
-------------	---

靶点	ADAM17/TACE
体外研究	TAPI-1 防止未受激的和 PMA 诱导的可溶性 TNF-alpha, p60 TNFR, 和 IL-6R 从单核细胞系, THP-1, 以及人外周血单核细胞中释放。TAPI-1 抑制 TACE 依赖性组成型共转染 APP(695)的释放。在人造血干细胞系 LI90 中, TAPI-1 减弱 Ang II 诱导的 EGFR 反式激活和细胞增殖。在 pSS 唾液腺衍生的上皮细胞中, TAPI-1 与 EGFR 抑制剂 AG1478 使 AREG/EGFR/ERK 信号通路失活, 并减少促炎性细胞因子释放。

美仑相关产品推荐

MB11996	肿瘤坏死因子 α -转移酶(ADAM-17)
MB11689	P75-肿瘤坏死因子受体片段
MB10210	[Ile76]-人肿瘤坏死因子-a (70-80)
MB12006	肿瘤坏死因子- α (10-36),人
MB12007	肿瘤坏死因子- α (31-45), 人
MB12008	肿瘤坏死因子- α (46-65), 人
MB12009	肿瘤坏死因子- α (71-82), 人
MB12010	肿瘤坏死因子- α (72-82), 人
MB12011	肿瘤坏死因子- α (78-96), 人
MB11680	P55-肿瘤坏死因子受体

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。TAPI-1 是一种 ADAM17/TACE 抑制剂, 其对细胞因子受体有抑制作用。可用于相关科研领域的研究。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0016 mL	10.0080 mL	20.0160 mL
5 mM	0.4003 mL	2.0016 mL	4.0032 mL
10 mM	0.2002 mL	1.0008 mL	2.0016 mL
50 mM	0.0400 mL	0.2002 mL	0.4003 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: LI90 细胞</p> <p>Concentrations: 20 μM</p> <p>Incubation Time: 60 小时</p> <p>Method: 五千个细胞接种到96孔板中, 它们的活性通过 CellTiter-Glo 发光细胞活性测定法评估。除去血清 24 小时后, 用每种抑制剂和拮抗剂预处理和没有预处理过的细胞用 Ang II 处理 60 小时。然后在板的每个孔中加入测定底物, 样品使用光度计进行评估。</p>
-------------	--

【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。