

## TLCK (N $\alpha$ -Tosyl-L-lysine chloromethyl ketone HCl)

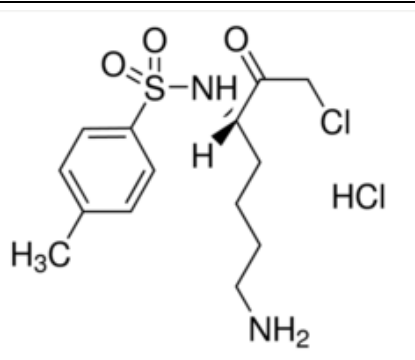
产品编号：MB3504

质量标准：≥96% (TLC), powder, sigma 进口分装

包装规格：20MG

产品形式：粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>14</sub> H <sub>21</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> S · HCl	结 构 式	
分子量	369.31		
CAS No.	4272-74-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性	Water (50mg/ml) Methanol(50 mg/ml) DMSO(5 mM)		
注意事项	为了您的安全, 请佩戴一次性手套。		
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：**TLCK 是丝氨酸蛋白酶、胰蛋白酶(在 pH 7.5 时, 胰蛋白酶失活最快)和许多类胰蛋白酶的不可逆抑制剂。位于酶活性部位的组氨酸-46 残基经 TLCK 烷基化。TLCK 不抑制胰蛋白酶原或胰蛋白酶抑制剂(如胰蛋白酶抑制剂)的复合物。

**别名：**(3S)-1-Chloro-3-tosylamido-7-amino-2-heptanone hydrochloride,  
(3S)-7-Amino-1-chloro-3-tosylamino-2-heptanone hydrochloride, TLCK,  
Tosyl-L-lysyl-chloromethane hydrochloride

### 物理性状及指标：

外观：..... 白色至粉红色粉末

溶解性：.....Water (50mg/ml); Methanol(50 mg/ml); DMSO(5 mM)

目标蛋白酶：.....胰蛋白酶

有效浓度：.....37-50 $\mu$ g/ml

**储存条件：**-20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

有文献报道了酶-TLCK 复合物的性质及肽胆碱甲酮的灭活机理。TLCK 还抑制纤溶酶、凝血酶(10mM TLCK 至 100 单位/ml 凝血酶)和巯基酶、ficin、菠萝蛋白酶、clostripain 和木瓜蛋白酶。报道了木瓜蛋白酶的抑制动力学。TLCK 烷基化巯基蛋白酶催化机制中所涉及的必需巯基, 而不是特定组氨酸残基的咪唑基(如胰蛋白酶和凝血酶的情况)。TLCK 能抑制小鼠颌下腺某些蛋白酶, 如内皮蛋白酶 Arg-C, 抑制内皮蛋白酶 Lys-C(1mM)。TLCK 是蛋白激酶 C 的有效抑制剂(IC<sub>50</sub>=1mM), 对家兔和大鼠肌肉中环腺苷酸依赖性蛋白激酶的催化亚基有抑制作用。TLCK 与人乳头瘤病毒 HPV-18E7 癌蛋白的 Rb 结合核发生反应, 破坏其 Rb 结合能力。TLCK(3 $\times$ 10<sup>-7</sup>-3 $\times$ 10<sup>-4</sup>M)抑制免疫刺激的小鼠和大鼠肺泡巨噬细胞体外产生一氧化氮。后来的研究报道 TLCK 干扰脂多糖诱导的大鼠肺泡巨噬细胞一氧化氮合酶基因表达。31TLCK(50 M)可阻止不同药物诱导的 HL-60 细胞和大鼠胸腺细胞凋亡过程中原位 DNA 内核溶解性断裂。TLCK 抑制胸腺细胞的凋亡

(很可能通过抑制胰蛋白酶样蛋白酶)。TLCK(IC<sub>50</sub>=50 nM)在不同细胞类型中抑制有丝分裂原诱导的pp70s6k的激活。33TLCK(135 nM)抑制纯化的CMP-唾液酸:乳糖神经酰胺 a(263)的活性。大鼠肝脏中的RSF (GM3合成酶, GM3神经节苷脂形成酶)。据报道, TLCK抑制了缺乏碳源和大分子合成的大肠杆菌细胞中的蛋白质分解。

**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。本品可阻断LPS-或细胞因子诱导的核因子κB (NF-κB) 的激活, 其反过来阻断iNOS和COX-2转录的诱导。阻止所有有丝分裂原激活pp70s6k。通过抑制某些细胞系中的半胱天冬酶的加工和某些刺激来阻断细胞系中的细胞凋亡。

#### 使用方法推荐

##### TLCK储存液的配制及保存 :

TLCK is soluble in water. Stock solutions of 10 mM can be prepared in 1 mM HCl, pH 3.0 or in buffer at pH # 6.0 (solutions are very unstable above pH 6.0 at 25°C, i.e. about 48% will decompose in about 5 minutes at pH 9.0). 1.5 Solutions should be prepared fresh. The effective concentrations are 10-100 μM. TLCK has also been solubilized in methanol at 50 mg/ml and in DMSO at a concentration of 5 mM.

##### 【注意】 :

- TLCK已用于制备无污染的胰酶(不受抑制)。为防止蛋白分离过程中的蛋白水解降解, 采用chymotrypsin抑制剂TLCK和TPCK (n-tosyl-L-苯丙氨酸氨甲基酮)各1 mM从鸡红细胞中分离组蛋白。TLCK疏水, 分子量相对较低, 可能穿透质膜在细胞内发挥作用, 即影响细胞凋亡事件。
- 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。

##### 参考文献 :

1. Shaw, E. et al., Biochem., 4, 2219, (1965)
2. Proteolytic Enzymes: A Practical Approach, R.J. Beynon and J.S. Bond, Eds., IRL Press, Oxford, England, 246, (1989).
3. Melkersen-Watson, L.J. and Sweeley, C.C., Biochem. Biophys. Res. Commun., 175, 325, (1991).
4. Needham, L. and Houslay, M.D., Biochem. Biophys. Res. Commun., 156, 855, (1988).
5. Fearnhead, H.O. et al. Toxicol. Lett., 82/83, 135, (1995).