

TPCA1 ; TPCA-1

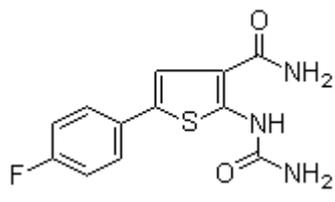
产品编号 : MB4260

质量标准 : >98% , IKK-2 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C12H10FN3O2S	结 构 式	
分子量	279.29		
CAS No.	507475-17-4		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 56 mg/mL (200.5 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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 : TPCA-1 是一种有效的, 选择性的 IKK-2 抑制剂。

别名 : 3-Thiophenecarboxamide, 2-[(aminocarbonyl)amino]-5-(4-fluorophenyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO : 56 mg/mL (200.5 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	TPCA-1 是一种 IKK-2 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 17.9 nM, 抑制 NF-κB 通路, 比作用于 IKK-1 选择性高 22 倍。
靶点	IKK2 (Cell-free assay) 17.9 nM
体外研究	在时间分辨荧光能量共振转移试验中, TPCA-1 抑制人 IKK-2 活性, IC50 为 17.9 nM。TPCA-1 被证明是 ATP 竞争性的。此外, TPCA-1 对 IKK-1 和 JNK3 分别表现出 400 nM 和 3600 nM 的 IC50 值。TPCA-1 浓度依赖性抑制 TNF-α, IL-6, 和 IL-8 的产生, IC50 值分

	别为 170, 290, 和 320 nM。TPCA-1 抑制胶质瘤细胞增殖, 以及 TNF 诱导的 RelA (p65) 核转运和 NFκB 依赖性 IL8 基因表达。重要的是, TPCA-1 抑制 IFN 诱导的基因表达, 完全抑制 MX1 和 GBP1 基因表达, 而对 ISG15 表达仅具有很小的作用。
体内研究	TPCA-1(3, 10, 或 20 mg/kg, i.p., b.i.d.)预防性给药, 导致小鼠体内胶原诱导性关节炎 (CIA)的严重程度剂量依赖性降低。TPCA-1(10 mg/kg, i.p., b.i.d.)导致的显著降低的疾病严重程度和疾病发作的延迟与抗风湿药, etanercept(4 mg/kg, i.p.)每隔一天预防性给药的作用相当。TPCA-1- 和 etanercept-处理的小鼠爪子组织中, p65 的细胞核定位, 以及 IL-1β, IL-6, TNF-α, 和干扰素-γ的水平显著降低。此外, TPCA-1 给药导致体内胶原诱导的 T 细胞增殖显著减少。TPCA-1 以 20 mg/kg, 而不是 3 或 10 mg/kg, i.p., b.i.d.治疗性给药显著降低 CIA 的严重程度, etanercept 以 12.5 mg/kg, i.p., 每隔一天给药具有同样的效果。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4261	IMD 0354
MB5540	IKK-16,选择性 IKK 抑制剂
MB5534	SC-514;IKK-2 抑制剂

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。TPCA-1 是一种有效的, 选择性的 IKK-2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.5805 mL	17.9025 mL	35.8051 mL
5 mM	0.7161 mL	3.5805 mL	7.1610 mL
10 mM	0.3581 mL	1.7903 mL	3.5805 mL
50 mM	0.0716 mL	0.3581 mL	0.7161 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>IKK-2 试验:</p> <p>重组人 IKK-2 (残基 1-756)在杆状病毒中以 N 端 GST 标记的融合蛋白表达, 其活性使用时间分辨荧光共振能量转移测定法进行评估。简而言之, IKK-2 (终浓度 5 nM)在试验缓冲液 (50 mM HEPES, 10 mM MgCl₂, 1 mM CHAPS, pH 7.4, 1 mM DTT 和 0.01% w/v BSA)中稀释, 加入包含不同浓度化合物或二甲基亚砜(DMSO)载体(终浓度 3%)的孔中。加入总体积为 30 μL 的 GST-IκBα 底物(终浓度 25 nM)/ATP (终浓度 1 μM)起始反应。反应在室温下培育 30 分钟, 然后加入 15 μL 50 mM EDTA 终止。加入包含 W-1024 铈螯合物标记</p>
-------------	---

	<p>的抗磷酸丝氨酸- IkBα-32/36 单克隆抗体 12C2, 和别藻蓝素标记的抗-GST 抗体的检测试剂(15 μL)缓冲液(100 mM HEPES, pH 7.4, 150 mM NaCl, 和 0.1% w/v BSA), 反应在室温下进一步培养 60 分钟。GST- IkBαis 的磷酸化程度以特定 665-nm 能量转移信号的比率, 参考值 620-nm 信号, 使用 Packard 探测酶标仪测量。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: U87, MT330, SJ-G2, 和 GBM6 人胶质瘤细胞系</p> <p>Concentrations: 0-50 μM</p> <p>Incubation Time: 3 天</p> <p>Method: 将来自储备液(10 mg/mL)的 10μL 3-(4,5-二甲基噻唑-2)-2,5-二苯基四氮唑溴盐 (MTT)加入包含胶质瘤细胞的 96 孔板中, 并在 37 $^{\circ}$C 下培育 2-4 小时。氧化的 MTT 通过将 100 μL 10%十二烷基硫酸钠(SDS)加入 0.01 N HCL 中溶解, 板在 37 $^{\circ}$C 下湿润的环境中培养 4 小时。板于 570 nm 下在酶标仪上读数。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 患有胶原诱导性关节炎的小鼠</p> <p>Formulation: 0.9% DMSO, 7% 二甲基乙酰基乙酰胺(DMA), 和 10% 聚氧乙烯蓖麻油</p> <p>Dosages: 3, 10, 或 20 mg/kg</p> <p>Administration: 通过腹腔注射给药, 每日两次</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, 否则会严重影响化合物活性, 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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差, 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。