

Resatorvid (TAK-242); 瑞沙托维

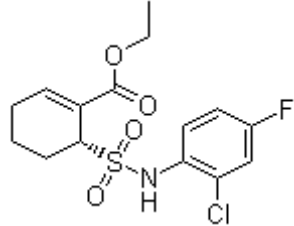
产品编号: MB7400

质量标准: >98%

包装规格: 5MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C15H17ClFNO4S	结 构 式	
分子量	361.82		
CAS No.	243984-11-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: ≥ 360 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: Resatorvid (TAK-242) 是一种有效的 TLR4 信号传导抑制剂, 可选择性地抑制 TLR-介导的细胞因子和一氧化氮的产生。

别名: 瑞沙托维; TAK-242; CLI-095; 1-Cyclohexene-1-carboxylic acid, 6-[[[2-chloro-4-fluorophenyl)amino]sulfonyl]-, ethyl ester, (6R)-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: ≥ 360 mg/mL

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	Resatorvid (TAK-242) 是一种有效的 TLR4 信号传导抑制剂, 可选择性地抑制 TLR-介导的细胞因子和一氧化氮的产生。
靶点	TLR4
体外研究	在 RAW264.7 细胞和小鼠腹腔巨噬细胞中, TAK-242 抑制脂多糖 (LPS) 诱导的 NO, 肿瘤坏死因子-α (TNF-α) 和白细胞介素 (IL) -6 的产生, IC50 为 1.1 至 11 nM。TAK-242 还抑制来自 LPS 刺激的人外周血单核细胞 (PBMC) 的这些细胞因子的产生, IC50 值为 11 至 33nM。
体内研究	TAK-242 明显降低了两种基因型小鼠的血清抗 dsDNA 水平。另外, tak-242 也明显抑制了 IFN-γ、TNF-α和 IL-1β的产生, 但其浓度仍远远高于 NS 处理的对照组。TAK-242 应激前给药可防止潜在有害炎症和氧化/硝化介质在大鼠大脑额叶皮层的积聚。TAK-242 静脉注射在应激期开始时完全阻断了应激暴露后 TLR-4 的 mRNA 和蛋白的上调。

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)

MB7452	Resiquimod(R848)
--------	------------------

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 Resatorvid (TAK-242)

是一种有效的 TLR4 信号传导抑制剂，可选择性地抑制 TLR-介导的细胞因子和一氧化氮的产生，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.7638 mL	13.8190 mL	27.6381 mL
5 mM		0.5528 mL	2.7638 mL	5.5276 mL
10 mM		0.2764 mL	1.3819 mL	2.7638 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>TAK-242 溶于 N, N-二甲基甲酰胺中，然后用适当的介质稀释后使用。</p> <p>RAW264.7 细胞以 3×10^6 细胞/孔的密度接种在 6 孔培养板中，培养过夜。用添加有 1%胎牛血清和 10μg/ml 卡那霉素的 RPMI 1640 培养基洗涤后，在有或无 TAK-242 (1-100 nM) 的情况下，用 5 ng/ml LPS 和 1 U/ml IFN-γ刺激细胞，持续时间为指示时间。去除培养上清液，使用总 RNA 分离试剂等原分离总 RNA。总 RNA 用 taqman 反转录试剂逆转录成 cDNA。利用预先开发的 Taqman 分析试剂和通用 PCR 主混合物，在 ABI Prism 7700 上对 TNF-α和 IL-6 进行定量实时 PCR 分析。用比较阈值循环法定量 mRNA。刺激达到的最高控制水平 (无 TAK-242) 被视为 100%，其他时间点的控制组和 TAK-242 添加组的水平被表示为最高控制水平的百分比。</p>
动物实验	<p>将 TAK-242 溶解在载体 (盐水) (小鼠) 中。</p> <p>将 TAK-242 溶于载体 (0.9%DMSO) (大鼠) 中。</p> <p>小鼠 C57BL / 6 背景 (雌性, 10 周龄) 的 30 只 ApoE^{-/-} 和 30 只野生型小鼠在标准光照条件下 (12 小时光暗) 喂食含有 0.25%胆固醇和 15%可可脂的高脂饮食循环) 和温度 (21\pm1$^{\circ}$C)。矿泉水随意饮用。将两种基因型的小鼠随机分配至 LPS 或 LPS + TAK-242 或盐水给药。分别通过腹膜内注射给予 LPS (2.5mg / kg) , LPS (2.5mg / kg) 加 TAK-242 (0.3mg / kg) 和盐水，每周两次，持续 4 周。在实验结束时，所有小鼠都接受了安乐死，注射过量戊巴比妥 (50mg / kg)。</p> <p>大鼠 使用最初重 200 至 225g 的雄性远交 Wistar Hannover 大鼠。TAK-242 是 i.v.在将动物引入塑料限制器后立即 (约 10 秒) 以 0.5mg / kg 的剂量注入尾静脉。该剂量是基于之前的体内研究选择的，该研究报告了其在暴露于缺氧的小胶质细胞中的抗炎/抗氧化和神经保护特性。浓度为 0.9%的二甲基亚砷用作载体。</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。

