

TCS 21311

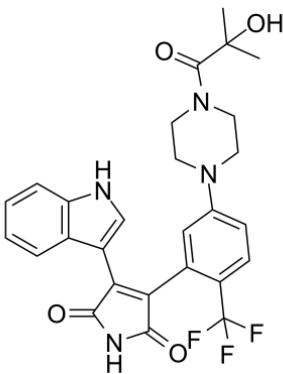
产品信息

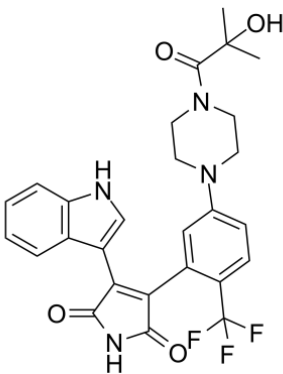
产品名称	产品编号	规格
TCS 21311	52981ES03	1 mg
	52981ES08	5 mg

产品描述

TCS 21311 (TCS21311, TCS-21311)是一种有效的高选择性的 JAK3 抑制剂,其 IC₅₀ 值为 8 nM,还可抑制 GSK-3β、PKCα 和 PKCθ,对应的 IC₅₀ 值分别为 3 nM、13 nM 和 68 nM。JAK 包含 JAK1/2/3,是蛋白酪氨酸激酶家族,可通过酪氨酸磷酸化转录激活蛋白 (STAT),在起始细胞因子触发的信号事件中起关键作用。JAK3 可作为治疗干预炎症性疾病、自身免疫性疾病、或器官移植排斥的重要靶点。TCS 21311 能阻断 PKC 触发的胞内信号。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	3-(5-(4-(2-Hydroxy-2-methyl-propionyl)-piperazin-1-yl)-2-trifluoromethyl-phenyl)-4-(1H-indol-3-yl)-pyrrole-2,5-dione; JAK3 Inhibitor XII; NIBR3049; NIBR 3049; NIBR-3049; TCS21311; TCS-21311
中文名称 (Chinese Name)	JAK3 抑制剂
靶点 (Target)	GSK-3β; PKCα; PKCθ; JAK3; JAK2; JAK1
CAS 号 (CAS NO.)	1260181-14-3
分子式 (Formula)	C ₂₇ H ₂₅ F ₃ N ₄ O ₄
分子量 (Molecular Weight)	526.51
外观 (Appearance)	固体粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	可溶于 DMSO
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃,有效期2年。建议分装后-20℃避光保存,避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康,请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心,以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。

4. 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

细胞实验（体外实验）

在酶促 Jak 分析实验中，TCS 21311 的 JAK1、JAK2 和 TYK2 的 IC_{50} 值分别为 1.017 μ M、2.550 μ M 和 8.055 μ M。TCS21311 抑制 PKC 和 Gsk3 β ， IC_{50} <1000 nM。TCS21311 对 Jak3 (IC_{50} =8 nM)有抑制作用。此外，TCS21311 还能抑制 PKC α 、Pkc θ 和 GSK3 β ， IC_{50} 值分别为 13 nM、68 nM 和 3 nM。TCS21311 在 Jurkat 细胞测定中表现出中等的活性(IC_{50} =689 nM)，这与其酶促 PKC 活性保持一致。数据表明 TCS21311 存在于细胞中，并能阻断 PKC 触发的细胞内过程。^[1]

参考文献

[1]. Thoma G, et al. Identification of a potent Janus kinase 3 inhibitor with high selectivity within the Janus kinase family. J Med Chem. 2011 Jan 13;54(1):284-8. doi: 10.1021/jm101157q. Epub 2010 Dec 14. PMID: 21155605.