

## TCS 21311

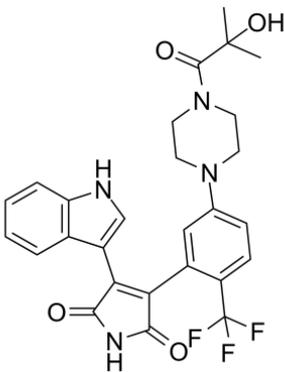
### 产品信息

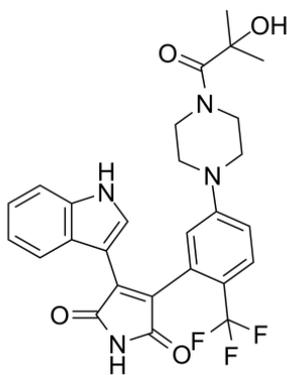
| 产品名称      | 产品编号      | 规格   |
|-----------|-----------|------|
| TCS 21311 | 52981ES03 | 1 mg |
|           | 52981ES08 | 5 mg |

### 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 IC<sub>50</sub> 值为 8 nM,还可抑制 GSK-3β、PKCα 和 PKCθ,对应的 IC<sub>50</sub> 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 <sub>27</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>  |
| 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  $\mu$ M、2.550  $\mu$ M 和 8.055  $\mu$ M。TCS21311 抑制 PKC 和 Gsk3 $\beta$ ， $IC_{50}$ <1000 nM。TCS21311 对 Jak3 ( $IC_{50}$ =8 nM)有抑制作用。此外，TCS21311 还能抑制 PKC $\alpha$ 、Pkc $\theta$  和 GSK3 $\beta$ ， $IC_{50}$  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。<sup>[1]</sup>

## 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.