

HB220614

TPCA-1

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53169ES08	5 mg
TPCA-1	53169ES10	10 mg
	53169ES25	25 mg

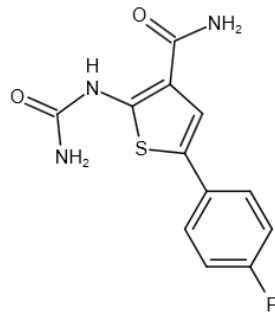
产品描述

TPCA-1 (GW683965; GW-683965; TPCA1; TPCA 1; IKK2 Inhibitor IV)是一种高效的 IKK-2 抑制剂, 其 IC₅₀ 为 17.9 nM, 抑制 NF-κB 信号通路, 其对 IKK-2 比对 IKK-1 的选择性高 20 多倍。TPCA-1 抑制 STAT3 磷酸化, 促进细胞凋亡。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GW683965; GW-683965; TPCA1; TPCA 1; IKK2 Inhibitor IV; 2-(carbamoylamino)-5-(4-fluorophenyl)thiophene-3-carboxamide
中文名称 (Chinese Name)	5-(4-氟苯基)-2-脲基噻吩-3-甲酰胺
靶点 (Target)	IKK; STAT; Apoptosis
通路 (Pathway)	NF-κB--IKK
CAS 号 (CAS NO.)	507475-17-4
分子式 (Formula)	C ₁₂ H ₁₀ FN ₃ O ₂ S
分子量 (Molecular Weight)	279.29
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	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°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C干燥保存, 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）

（一）细胞实验（体外实验）

TPCA-1 (IC₅₀=170-320 nM)抑制脂多糖诱导的人单核细胞产生 TNF- α 、IL-6 和 IL-8。^[1] TPCA-1 (0-2 μ M)以剂量和时间依赖性方式抑制细胞因子和非受体酪氨酸激酶诱导的 STAT3 磷酸化和反式激活。TPCA-1 完全抑制 STAT3 的磷酸化而不改变总的 STAT3 水平。TPCA-1 在 TKI 敏感细胞和不敏感细胞中均增加了对 ZD1839 的敏感性。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

TPCA-1 (10 mg/kg/d; 腹腔注射)可抑制具有 EGFR 突变的 NSCLC 的生长，并增强 ZD1839 在异种移植模型中的抗肿瘤作用。^[2] TPCA-1 (3, 10, 20 mg/kg; 腹腔注射)导致鼠胶原性关节炎(CIA)的严重程度呈剂量依赖性降低。^[3]

参考文献

- [1] Sachse F, et al. IKK-2 inhibitor TPCA-1 represses nasal epithelial inflammation in vitro. *Rhinology*. 2011 Jun;49(2):168-73.
- [2] Nan J, et al. TPCA-1 is a direct dual inhibitor of STAT3 and NF- κ B and regresses mutant EGFR-associated human non-small cell lung cancers. *Mol Cancer Ther*. 2014 Mar;13(3):617-29.
- [3] Podolin PL, et al. Attenuation of murine collagen-induced arthritis by a novel, potent, selective small molecule inhibitor of IkappaB Kinase 2, TPCA-1 (2-[(aminocarbonyl)amino]-5-(4-fluorophenyl)-3-thiophenecarboxamide), occurs via reduction of proinflamm.