

Tanzisertib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Tanzisertib	53801ES08	5 mg
	53801ES25	25 mg

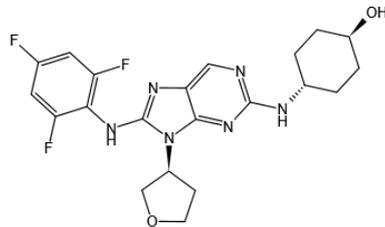
产品描述

Tanzisertib (CC-930, JNK-930, JNKI-1, JNK930, JNKI1), 是 JNK1/2/3 选择性抑制剂, IC₅₀ 值分别为 61 nM、7 nM 和 6 nM, 目前正在临床上开发用于纤维化和炎症适应症。JNKs 属于 MAPK 家族, 调节很多重要的细胞功能, 如细胞增殖、分化、存活和凋亡。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Tanzisertib, CC-930, JNK-930, JNKI-1, JNK930, JNKI1
靶点 (Target)	JNK1/2/3
通路 (Pathway)	MAPK/ERK--JNK
CAS 号 (CAS NO.)	899805-25-5
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₂₃ F ₃ N ₆ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	448.44
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 3 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)

Tanzisertib (1-2 μ M)可显著减少游离胆固醇导致的肝细胞的细胞凋亡和坏死。^[2]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 LPS 诱导 TNF α 生成的急性 PK-PD 大鼠中,口服 Tanzisertib (10 or 30 mg/kg)有效减少 TNF α 的生成。^[1] 在受到博来霉素攻击的小鼠和 TSK1 小鼠中, Tanzisertib 以剂量依赖性方式抑制 JNK, 阻止真皮增厚、肌成纤维细胞分化和胶原蛋白积累, 发挥抗纤维化作用。^[3]

参考文献

- [1]. Plantevin Krenitsky V, et al. Discovery of CC-930, an orally active anti-fibrotic JNK inhibitor. *Bioorg Med Chem Lett*. 2012 Feb 1;22(3):1433-8.
- [2]. Gan LT, et al. Hepatocyte free cholesterol lipotoxicity results from JNK1-mediated mitochondrial injury and is HMGB1 and TLR4-dependent. *J Hepatol*. 2014 Dec;61(6):1376-84.
- [3]. Reich N, et al. Jun N-terminal kinase as a potential molecular target for prevention and treatment of dermal fibrosis. *Ann Rheum Dis*. 2012 May;71(5):737-45.