

Resatorvid 瑞沙托维 TAK-242, CLI-095 (TLR4 抑制剂)

产品简介

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。

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-1 β 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。

产品组成

名称	编号	FS1309	Storage
Resatorvid 瑞沙托维		5MG	4°C
使用说明书		1 份	

产品属性

CAS : 243984-11-4

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

分子式: C₁₅H₁₇ClFNO₄S

分子量: 361.82

纯度: $\geq 99\%$

外观: 白色至类白色固体

溶解性: DMSO: ≥ 360 mg/mL

存储条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥保存

储液配置

体 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

实验操作 (仅供参考)

细胞实验	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>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 10 $\mu\text{g/ml}$ 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>
<p>动物实验</p>	<p>将 TAK-242 溶解在载体 (盐水) (小鼠) 中。 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 ($21 \pm 1^\circ\text{C}$)。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>

注意事项

- 1) 用于细胞培养配液时请注意灭菌处理。
- 2) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。