

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	E10008
产品名称:	E6446 HCl

产品简介:

一种有效的、可口服的 TLR7 和 TLR9 拮抗剂,可用于有害炎症反应的研究。E6446 dihydrochloride 还是强效的 SCD1 抑制剂 (KD: 4.61 μ M), 通过 SCD1-ATF3 信号传导显着抑制脂肪形成分化和肝脂肪生成。E6446 dihydrochloride 还改善高脂饮食 (HFD) 喂养小鼠的肝脏病变, 可用于非酒精性脂肪肝病 (NAFLD) 的研究。

靶点:	TLR7	TLR9
-----	------	------

体外研究:

E6446 dihydrochloride 是一种有效的口服活性 TLR7 和 TLR9 抑制剂。E6446 dihydrochloride 有效抑制 HEK:TLR9 细胞的 DNA 刺激, IC50 值为 10 nM, 但在抑制 HEK:TLR4 细胞的 LPS 内毒素刺激或 HEK:TLR7 细胞的 R848 刺激方面效果明显较差。E6446 dihydrochloride 有效抑制 CpG2216 诱导的 IL-6 产生, 但对 TLR3 配体聚肌苷-胞嘧啶的诱导无效。E6446 dihydrochloride 抑制 TLR7 的能力是配体依赖性的, E6446 dihydrochloride 是 RNA 诱导 IL-6 的有效抑制剂, 但对小分子咪唑喹啉配体 R-848 诱导 IL-6 的抑制剂相对较弱。E6446 dihydrochloride 在体外抑制 TLR9-DNA 相互作用, IC50 在 1 到 10 μ M 范围内。E6446 dihydrochloride (0.01-0.03 μ M) 用 CpG ODN 2006 特异性抑制 TLR9 激活, 并在 2-8 μ M 时阻断由咪唑喹啉化合物 R848 激活的 TLR7/8。E6446 dihydrochloride 在 30 μ M 时减少 50% 的 TLR4 激活, 并且在使用 oligo 2006 刺激的 HEK-TLR9 细胞和用 oligo 2216 刺激的人 PBMC 中显示 IC50 分别为 0.01 μ M 和 0.23 μ M。

体内研究:

E6446 dihydrochloride (20 mg/kg, 口服) 几乎完全抑制 CpG1668 诱导的 IL-6 产生, 并在 20 和 60 mg/kg 剂量依赖性地抑制小鼠体内 ANA (抗核抗体) 的产生。E6446 dihydrochloride (20, 60 mg/kg, po) 剂量依赖性地抑制小鼠中的 TLR9 信号传导。E6446 dihydrochloride (60、120 mg/kg, 口服) 可防止啮齿动物疟疾中 TLR 的高反应性和 LPS 诱导的感染性休克, 降低急性疟疾期间的 TLR 反应性, 抑制 TLR7 和 TLR9 的激活。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 溶于 DMSO (7mg/mL)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	1.9138 mL	9.5692 mL	19.1384 mL
5 mM	0.3828 mL	1.9138 mL	3.8277 mL
10 mM	0.1914 mL	0.9569 mL	1.9138 mL
储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year.			

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。





Beijing Psaitong
Biotechnology Co., Ltd

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20℃

*更多产品请登陆官网查询。
*本公司产品仅用于科研。

真实 准确 稳定 负责

010-60605840
www.jm-bio.com
psaitong@jm-bio.com

