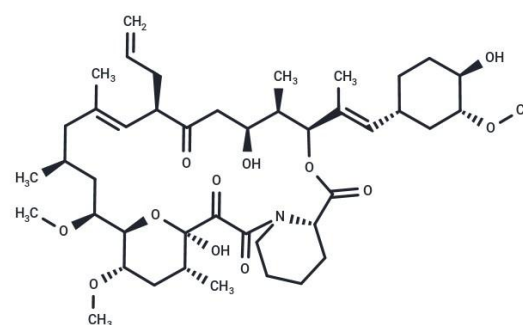


Tacrolimus(他克莫司)(免疫抑制剂)

货号: RPM0029

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	Tacrolimus(他克莫司)(免疫抑制剂)
别称/Synonyms:	Fujimycin, 他克莫司, FK506, FR900506
CAS 号/CAS NO.:	104987-11-3
化学式/Formula:	$C_{44}H_{69}NO_{12}$
分子量/M.Wt:	804.02
外观/Appearance:	固体
保存条件/Storage:	Powder: -20°C , 3 年 Insolvent: -80°C , 1 年



◆ 溶解信息

溶解度/Solubility:	Ethanol:	80.4 mg/mL (100 mM)
	DMSO:	45 mg/mL (55.97 mM)
	10% DMSO+40% PEG300+5% Tween 80+45%	8.04 mg/mL (10 mM), 现配现用
	Saline:	

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.2438 mL	6.2188 mL	12.4375 mL
5 mM	0.2488 mL	1.2438 mL	2.4875 mL
10 mM	0.1244 mL	0.6219 mL	1.2438 mL
50 mM	0.0249 mL	0.1244 mL	0.2488 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	Tacrolimus (Fujimycin) 属于大环内酯类抗生素, 可以与 FKBP12 结合形成高亲和力复合物 ($K_i=0.2$ nM), 抑制钙/钙调蛋白依赖性蛋白磷酸酶的活性。Tacrolimus 是一种免疫抑制剂, 通过抑制 IL-2 的释放, 全面抑制 T 淋巴细胞的作用。
靶点活性/Targets (EC_{50})	Phosphatase, Antibacterial, Antibiotic, mTOR, Autophagy

体外活性/In vitro	人肾上皮细胞 HK-2 用 Tacrolimus (1-20 μ M) 处理 48 h, 使用 resazurin reduction assay 测定细胞活力。结果显示 12 μ M Tacrolimus 不会导致 resazurin 转化率的显著变化, 而 14-20 μ M Tacrolimus 导致 resazurin-reduction 的统计学显著降低, 表明 Tacrolimus 处理后 HK-2 细胞的活力降低。 ^[1]
体内活性/In vivo	为测试体内免疫抑制活性, 将 Tacrolimus (4 mg/kg in Cremaphor) 腹腔注射给酒精/四氯化碳诱导的大鼠肝纤维化模型, 每天一次, 持续四周。结果显示 Tacrolimus 完全阻止了酒精/四氯化碳诱导的大鼠肝纤维化的发展。Tacrolimus 处理的肝脏中没有肝星状细胞的激活, 胶原 α 2 (I) mRNA 的表达处于正常水平。 ^[2]
动物实验/Animal Research	Evaluated the effect of tacrolimus (1, 2 and 3 mg/kg, p.o. for 10 consecutive days) on femoral arterial ischemic reperfusion (I/R) induced neuropathic pain in rats. Behavioral parameters (i.e. hot plate, radiant heat, acetone drop, tail heat hyperalgesia, tail flick and tail cold allodynia tests) were assessed at different time intervals (i.e. 0, 1, 4, 7, 10, 13 and 16th day) and biochemical analysis in serum and tissue samples were also performed along with histopathological studies.results indicate the anti-oxidative, anti-inflammatory and calcium modulatory actions of tacrolimus. ^[3]

◆ 参考文献

[1] Bennett J, et al. Tacrolimus Modulates TGF- β Signaling to Induce Epithelial-Mesenchymal Transition in Human Renal Proximal Tubule Epithelial Cells. J Clin Med. 2016 Apr 26;5(5):50.

[2] Manojlovic Z, et al. Tacrolimus (FK506) prevents early stages of ethanol induced hepatic fibrosis by targeting LARP6 dependent mechanism of collagen synthesis. PLoS One. 2013 Jun 3;8(6):e65897.

[3] Muthuraman A, Sood S. Pharmacological evaluation of tacrolimus (FK-506) on ischemia reperfusion induced vasculatic neuropathic pain in rats. J Brachial Plex Peripher Nerve Inj. 2010 Jun 7;5:13. doi: 10.1186/1749-7221-5-13. PMID: 20529260; PMCID: PMC2890670.

◆ 注意事项

1. 请在收到本产品后立即按照说明书中推荐的条件保存, 使用前进行离心, 使粉末充分沉降至管底。
2. 请根据实验目的及本产品的溶解性, 选择相应的溶剂配制高浓度母液后使用, 最佳工作浓度请参考相关文献通过实验摸索优化, 本说明书中的数据来源于公开文献, 仅供参考。
3. 本产品仅供科研使用, 不可用于诊断或治疗领域。
4. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。