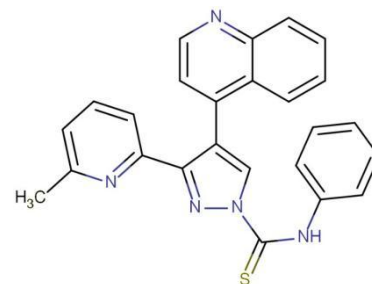


A 83-01 (ALK5 抑制剂)

货号: RPM0008

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	A 83-01
别称/Synonyms:	3-(6-甲基-2-吡啶基)-N-苯基-4-(4-喹啉基)-1H-吡唑-1-硫代甲酰胺
CAS 号/CAS NO.:	909910-43-6
化学式/Formula:	C ₂₅ H ₁₉ N ₅ S
分子量/M.Wt:	421.52
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:	DMSO: 10 mg/mL (23.72 mM) 该化合物在溶液中不稳定, 请尽快使用。
-----------------	---

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3724 mL	11.8618 mL	23.7237 mL
5 mM	0.4745 mL	2.3724 mL	4.7447 mL
10 mM	0.2372 mL	1.1862 mL	2.3724 mL
50 mM	0.0474 mL	0.2372 mL	0.4745 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	A 83-01 是一种 TGF-βI 型受体 ALK5、ALK4 和 ALK7 的抑制剂, 可促进小鼠成纤维细胞重编程为 iPSCs, 可用于类器官培养。
靶点活性/Targets (IC ₅₀)	ALK5: 12 nM, ALK4: 45 nM, ALK7: 7.5 nM
体外活性/In vitro	1.用 A 83-01 (0.03-10 μM) 和 TGF-β (1 ng/mL) 处理野生型水貂肺上皮细胞 Mv1Lu 48 h, Coulter counter 检测细胞增殖。A 83-01 以剂量依赖的方式阻止 TGF-β 对 Mv1Lu 细胞生长的抑制。 ^[1] 2.用 A 83-01 (1-10 μM) 处理小鼠卵巢癌细胞 HM-1 30 min, 随后用 TGF-β (1-10 ng/mL) 处理 60 min, Western Blot 检测靶点蛋白表达水平。添加 TGF-β1 增加了 pSmad3 的表达, A 83-01 抑制了 TGF-β 的上调。 ^[2]
体内活性/In vivo	1.将 A 83-01 (150 μg/只) 腹腔注射给 HM-1 癌症腹膜扩散的 B6C3F1 小鼠模型, 每周三次, 持续四周, 检测体内抗肿瘤活性。A 83-01 治疗组的腹水形成

	往往较慢，A 83-01 显著提高了小鼠的存活率。^[2] 2.将 A 83-01 (10 mg/kg) 腹腔注射给 Nkx2.5 enh-Cre/mTmG 小鼠，每天一次，持续七天，研究在心肌损伤中的作用。A 83-01 治疗在基线和心肌损伤后显著增加了 Nkx2.5+心肌成肌细胞的数量，导致新形成的心肌细胞增加，A 83-01 治疗显著改善了心室弹性和卒中功，从而改善了损伤后的收缩能力。^[3]
细胞实验/Cell Research	HM-1 cells are seeded into a 96-well plate and are incubated for 18 hr. A-83-01 (1 μM) or vehicle are then added for 12 hr followed by the addition of TGF-β1 (1 ng/mL) or vehicle for 60 hr. The number of viable cells in each well is examined using the WST-1 assay following the manufacturer's instructions.

◆ 参考文献

- [1] Tojo M, et al. The ALK-5 inhibitor A-83-01 inhibits Smad signaling and epithelial-to-mesenchymal transition by transforming growth factor-beta. *Cancer Sci.* 2005 Nov;96(11):791-800.
- [2] Yamamura S, et al. The activated transforming growth factor-beta signaling pathway in peritoneal metastases is a potential therapeutic target in ovarian cancer. *Int J Cancer.* 2012 Jan 1;130(1):20-8.
- [3] Chen WP, et al. Pharmacological inhibition of TGF β receptor improves Nkx2.5 cardiomyoblast-mediated regeneration. *Cardiovasc Res.* 2015 Jan 1;105(1):44-54.

◆ 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成高浓度母液后使用，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。