

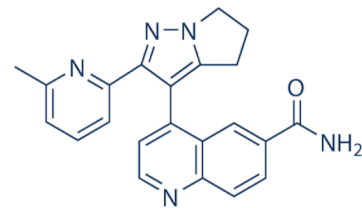
Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF7926-10mM	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	10mM×0.2ml
SF7926-5mg	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	5mg
SF7926-25mg	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[2-(6-methylpyridin-2-yl)-5,6-dihydro-4H-pyrrolo[1,2-b]pyrazol-3-yl]quinoline-6-carboxamide
简称	Galunisertib
别名	LY2157299, LY 2157299, LY-2157299
中文名	N/A
化学式	C ₂₂ H ₁₉ N ₅ O
分子量	369.42
CAS号	700874-72-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.35ml DMSO, 或每3.69mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF7926-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Galunisertib (LY2157299)是有效的TGFβ receptor I (TβRI)抑制剂, 无细胞试验中IC50为56nM。Phase 2/3。				
信号通路	TGF-beta/Smad; Stem Cells & Wnt				
靶点	TβRI	—	—	—	—
IC50	56nM	—	—	—	—
体外研究	LY2157299有效地抑制了TGFβ受体信号。LY2157299抑制了HUVEC细胞中TGFβ诱导的Smad2的磷酸化。在HUVEC细胞中, LY2157299也呈剂量依赖性增强了VEGF或bFGF在血管内皮细胞诱导的细胞增殖作用。LY2157299也促进VEGF诱导的HUVEC细胞迁移。在体外的VEGF刺激的帘线形成测定中, LY2157299可加强血管生成。在初级造血干细胞中, LY2157299以剂量依赖的方式抑制TGF-β介导的SMAD2活化和造血抑制。LY2157199刺激原发性MDS骨髓的造血功能。在人类胶质母细胞瘤(GBM)细胞中, LY2157299通过TGFβ受体复合物处抑制信号通路活性, 减少活性磷酸化SMAD的水平。				
体内研究	虽然抗肿瘤活性已经在一些临床前模型中观察到了, 但在4T1、Colo205或A549异种移植模型中, LY2157299并没有显著抑制体内血管生成的作用。在TGF-β过度表达的转基因骨髓造血功能衰竭小鼠模型中, LY2157299可改善贫血。在Calu6和MX1异种移植小鼠中, LY2157299(75mg/kg/day, 口服)给药显示显著抗肿瘤活性。在体内基质胶栓法检测中, LY2157299诱导血管生成并增强VEGF和碱性成纤维细胞生长因子诱导的血管生成, 而在基底膜中添加alpha5-整合素中和抗体抑制这种增强应答。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	反应: 170-200nM酶在1×KB(50mM Tris pH 7.5, 150mM NaCl, 4mM MgCl ₂ , 1mM NaF, 2mM的β-巯基乙醇), LY2157299梯度稀释在1×KB/16% DMSO(至20μM到1nM的最终浓度, DMSO的最终浓度为4%)中, 反应是通过在1×KB中加入ATP混合物开始的(4μM ATP/1微居里33P-α-ATP终浓度)。反应于30°C进行1小时。反应停止, 并用标准的三氯乙酸/BSA沉淀到Millipore公司的FB的玻璃纤维过滤板和通过在MicroBeta对喷射液体闪烁计数定量。

细胞实验

细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	裸鼠皮下植入Calu6或MX1细胞
配制	溶解于DMSO中并稀释于生理盐水
剂量	75mg/kg/day
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

- 1.Zhou L, et al. Cancer Res, 2011, 71(3), 955-963.
- 2.Bueno L, et al. Eur J Cancer, 2008, 44(1), 142-150.
- 3.Liu Z, et al. J Cell Sci, 2009, 122(18), 3294-3302.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF7926-10mM	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	10mM×0.2ml
SF7926-5mg	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	5mg
SF7926-25mg	Galunisertib (TGF-β/Smad抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01