

SB505124

产品信息

产品名称	产品编号	规格
SB505124	53029ES10	10 mg
	53029ES50	50 mg

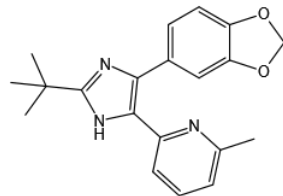
产品描述

SB505124 (SB-505124)是一种转化生长因子 β I型受体(TGF β R) ALK4/5/7 的选择性抑制剂, 抑制 ALK4 和 ALK5, IC₅₀ 分别为 129 nM 和 47 nM, 但不影响 ALK1/2/3/6 活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	SB505124, SB-505124
中文名称 (Chinese Name)	2-(5-苯并[1,3]二氧代 1-5-基-2-叔丁基-3H-咪唑-4-基)-6-甲基吡啶
靶点 (Target)	ALK4/5/7
CAS 号 (CAS NO.)	694433-59-5
分子式 (Formula)	C ₂₀ H ₂₁ N ₃ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	335.4
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥ 98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻融。

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。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件(如实验目的, 细胞种类, 培养特性等)进行摸索和优化。】

使用方法(数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验(体外实验)

SB-505124 浓度即使高达 10 μ M 时也不抑制 ALK2。100 μ M SB-505124 处理 A498 细胞 48 h, 对细胞没有毒性。5 μ M

SB-505124 作用于 COS-1 细胞, 抑制内源性 Smad2 磷酸化, 但不影响 ALK1/2/3/6 介导的 Smad1 磷酸化。SB-505124 作用于 HepG2 细胞、C2C12 细胞和 Mv1Lu 细胞, 抑制 TGF- β 诱导的 Smad2 磷酸化, 这种作用存在浓度依赖性。SB-505124 作用于 FaO 和 NRP 154 细胞, 抑制 TGF β 诱导的凋亡。^[1] 1 μ M SB-505124 作用于大鼠原代神经元, 抑制 Smad2 磷酸化, CTGF 与 α -SMA 的表达。^[2] 0.5 μ M SB-505124 作用于 HUVEC 细胞, 抑制 TGF- β 诱导的 ROS 产生。^[3] 5 μ M SB-505124 作用于肺癌细胞系(A549, NCI-H358, NCI-H727, NCI-H2009), 促进对顺铂的敏感性。^[4]

(二) 动物实验 (体内实验)

在肺癌移植瘤小鼠模型中, 每两日腹腔注射 5 mg/kg 的 SB-505124, 促进瘤体对顺铂 (单次 60 mg/kg) 的敏感性, 并且不需要持续顺铂治疗。^[4]

参考文献

- [1]. DaCosta Byfield S, et al. SB-505124 is a selective inhibitor of transforming growth factor-beta type I receptors ALK4, ALK5, and ALK7. *Mol Pharmacol.* 2004;65(3):744-52.
- [2]. Misumi S, et al. Enhanced neurogenesis from neural progenitor cells with G1/S-phase cell cycle arrest is mediated by transforming growth factor β 1. *Eur J Neurosci.* 2008;28(6), 1049-1059.
- [3]. Hu T, et al. Reactive oxygen species production via NADPH oxidase mediates TGF- β -induced cytoskeletal alterations in endothelial cells. *Am J Physiol Renal Physiol.* 2005;289(4).
- [4]. Marini KD, et al. Inhibition of activin signaling in lung adenocarcinoma increases the therapeutic index of platinum chemotherapy. *Sci Transl Med.* 2018;10(451): eaat3504.