

HB221111

R-268712

产品信息

产品名称	产品编号	规格
R-268712	53415ES08	5 mg
	53415ES10	10 mg

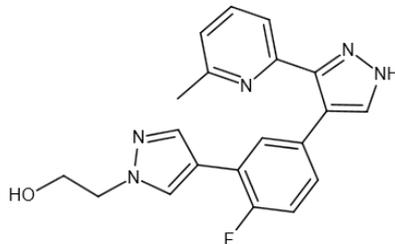
产品描述

R-268712 (R268712; R 268712)可呈剂量依赖性抑制 Smad3 的磷酸化, 在 HFL-1 细胞中 IC₅₀ 为 10.4 nM, 还以剂量依赖性方式抑制肾荧光素酶活性, 表现出肾保护作用, 改善和维持肾功能以及抑制肾小球硬化症。

产品性质

靶点 (Target)	TGFBR1; Smad3
通路 (Pathway)	TGF-beta/Smad—TGF-β Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	879487-87-3
分子式 (Formula)	C ₂₀ H ₁₈ FN ₅ O
分子量 (Molecular Weight)	363.39
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 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 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。

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 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）

R-268712 (3, 10, 30, 100, 300 nM; 1 h) 以剂量依赖性方式抑制 Smad3 的磷酸化, 在 HFL-1 细胞中 IC_{50} 为 10.4 nM。R-268712 (3, 10, 30, 100, 300 nM; 72 h) 以剂量依赖性方式抑制成纤维细胞的肌成纤维细胞转分化(MTD), 而不抑制 HFL-1 细胞中的细胞生长。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

R-268712 (0.3, 1, 3, 10 mg/kg; p.o.; 单剂量) 显示每个剂量对应的 AUC_{0-24} 值分别为 0.075, 0.28, 1.6, 8.2 $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ 。R-268712 (1, 3, 10 mg/kg; 口服; 每日单次; 持续 3 天) 在 UUO 模型中以剂量依赖性方式抑制肾荧光素酶活性。R-268712 (0.3, 1 mg/kg; 口服; 每日单次; 持续 33 天) 在 1 mg/kg 剂量下对 Thy1 肾炎模型显示肾保护作用（改善和维持肾功能以及抑制肾小球硬化症）。^[2]

参考文献

- [1]. Terashima H, et al. Attenuation of pulmonary fibrosis in type I collagen-targeted reporter mice with ALK-5 inhibitors. *Pulm Pharmacol Ther.* 2019 Feb; 54:31-38.
- [2]. Terashima H, et al. R-268712, an orally active transforming growth factor- β type I receptor inhibitor, prevents glomerular sclerosis in a Thy1 nephritis model. *Eur J Pharmacol.* 2014 Jul 5; 734:60-6.