

HB181218

FR 180204

产品信息

产品名称	产品编号	规格
FR 180204	52015ES08	5 mg
FR 180204	52015ES25	25 mg

产品描述

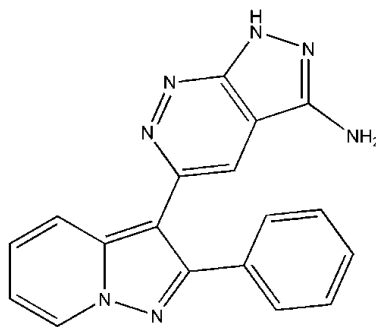
FR 180204 是一种选择性、细胞通透的、ATP 竞争性的 ERK 抑制剂, 抑制 ERK1 和 ERK2 激酶活性, K_i 值分别为 0.31 和 0.14 μM 。在水貂肺上皮细胞 Mv1Lu 中, FR 180204 抑制 TGF β 诱导的荧光素酶表达。在胶原诱导的关节炎 (CIA) 小鼠中, FR 180204 显著改善关节炎症状, 并减少小鼠体重损失, 小鼠血浆中抗 II 型胶原 (CII) 抗体水平显著降低。FR 180204 还可以抑制 T 细胞抗原特异性的活化, 在疾病的起始和进展中起着重要作用。另外, 注射登革病毒 (DENV) 的小鼠模型中, FR 180204 限制肝细胞凋亡, 减少 DENV 诱导的肝脏损伤, 并提高临床指标, 如白细胞减少、血小板减少等。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	FR180204, FR-180204, ERK Inhibitor II
化学名 (Chemical Name)	5-(2-phenylpyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl)-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridazin-3-amine
靶点 (Target)	ERK
CAS 号 (CAS NO.)	865362-74-9
分子式 (Molecular Formula)	C ₁₈ H ₁₃ N ₇
分子量 (Molecular Weight)	327.34
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20 $^{\circ}\text{C}$, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 -20 $^{\circ}\text{C}$ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

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) 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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

FR 180204 抑制 ERK1 和 ERK2 激酶活性， K_i 值分别为 0.31 和 0.14 μM 。在水貂肺上皮细胞 Mv1Lu 中，FR 180204 抑制 TGF β 诱导的荧光素酶表达。^[1]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，用 FR180204 (100 mg/kg, i.p., b.i.d.) 处理胶原诱导性类风湿性关节炎 (RA) 小鼠，FR180204 显著改善 CIA 小鼠的症状，并减少小鼠体重的损失。FR180204 处理的小鼠血浆中抗 II 型胶原 (CII) 抗体水平显著降低 (62%)。另外，FR180204 可以降低 CII 免疫的 DBA/1 小鼠的迟发型超敏反应，该作用方式为剂量依赖型，32 和 100 mg/kg 剂量的抑制作用分别为 52% 和 62%。^[2]

参考文献

- [1] Ohori M, et al. Identification of a selective ERK inhibitor and structural determination of the inhibitor-ERK2 complex. *Biochem Biophys Res Commun.* 336(1): 357-363 (2005).
- [2] Ohori M, et al. FR180204, a novel and selective inhibitor of extracellular signal-regulated kinase, ameliorates collagen-induced arthritis in mice. *Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol.* 374(4): 311-316 (2007).
- [3] Ohori M, et al. ERK inhibitors as a potential new therapy for rheumatoid arthritis. *Drug News Perspect.* 21(5): 245-250 (2008).
- [4] Sreekanth GP, et al. Role of ERK1/2 signaling in dengue virus-induced liver injury. *Virus Res.* 188: 15-26 (2014).