

HB211115

## A 83-01

### 产品信息

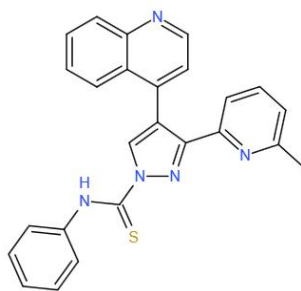
产品名称	产品编号	规格
	53002ES03	1 mg
A 83-01	53002ES08	5 mg
	53002ES10	10 mg

### 产品描述

A 83-01 是一个强有力的 TGF- $\beta$  I型受体 ALK5 (IC<sub>50</sub>: 12 nm) / ALK4 ((IC<sub>50</sub>: 45 nm) / ALK 7 (IC<sub>50</sub>: 7.5 nm) 激酶的抑制剂, A 83-01 对 ALK5 的抑制作用很强, 可以抑制 Smad2/3 的磷酸化和 TGF- $\beta$  诱导的生长。A 83-01 对骨形态发生蛋白 I 型受体、p38 丝裂原活化蛋白激酶或细胞外调节激酶的作用很小或没有作用。同时, A 83-01 可抑制 TGF- $\beta$  诱导的上皮-间充质转移, 表明 A 83-01 可能有助于抑制晚期癌症的进程。

### 产品性质

中文名称 (Chinese Name)	3-(6-甲基-2-吡啶基)-N-苯基-4-(4-噻啉基)-1H-吡唑-1-硫代甲酰胺
靶点 (Target)	ALK7; ALK5; ALK4;
CAS 号 (CAS NO.)	909910-43-6
分子式 (Formula)	C <sub>25</sub> H <sub>19</sub> N <sub>5</sub> S
分子量 (Molecular Weight)	421.52
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℃, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20℃避光保存, 避免反复冻融。产品在溶液状态下不稳定, 建议现配现用。

### 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。】

## 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）

A 83-01（1  $\mu$ M）刺激野生型或突变型貂肺上皮细胞，发现 A 83-01 对 ALK5 的抑制作用比之前描述的 ALK-5 抑制剂 SB-431542 更强，也可以抑制 Smad2/3 的磷酸化和 TGF- $\beta$ 诱导的生长。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

A 83-01（10 mg/kg）作用于 8-10 周的 Nkx2.5 enh-Cre/mTmG 小鼠 7 天时间，A83-01 治疗可促进心脏 Nkx2.5-GFP<sup>+</sup>细胞在体内的扩张和心肌分化。<sup>[2]</sup>

## 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]. Chen WP, et al. Pharmacological inhibition of TGF $\beta$  receptor improves Nkx2.5 cardiomyoblast-mediated regeneration. *Cardiovasc Res.* 2015 Jan 1;105(1):44-54.
- [3]. Kim Y, et al. Small molecule-mediated reprogramming of human hepatocytes into bipotent progenitor cells. *J Hepatol.* 2019 Jan;70(1):97-107.