



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

产品名称: **CS-2835; SM 16**

CAS 号: **614749-78-9**

产品货号: **S87725**

生物活性:				
Description	SM 16 是 ALK5/ALK4 激酶抑制剂, Ki 值分别为 10 和 1.5 nM。			
IC50 & Target	Ki: ALK5 (10 nM), ALK4 (1.5 nM)[1]			
In Vitro	SM 16 在浓度为 100 到 620 nM 时抑制 TGF β 诱导的结缔组织生长因子抑制剂-荧光素酶活性 (IC50=64 nM) 和 TGF β -或激活素诱导的 Smad2 磷酸化。SM 16 针对 >60 种相关和无关激酶进行了测试, 仅针对 Raf (IC50=1 μ M) 和 p38/SAPKa (IC50=0.8 μ M)。SM 16 对 ALK 家族成员 ALK1 和 ALK6 没有抑制活性[1]。			
In Vivo	SM 16 体内 穿透肿瘤细胞, 在用 20 mg/kg SM 16 单次腹腔推注处理荷瘤小鼠后抑制肿瘤磷酸化 Smad2/3 水平至少 3 小时。已建立的 AB12 肿瘤在 28 天内通过皮下微渗透泵递送 5 mg/kg/d SM 16 (P<0.001) 显著抑制[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 65 mg/mL (150.99 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing	Solvent Concentration	Mass Concentration	
		1 mM	2.3229 mL	11.6144 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4646 mL	2.3229 mL
		10 mM	0.2323 mL	1.1614 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: $\geq$ 2.58 mg/mL (5.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.58 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE- β -CD in Saline)				



	Solubility: $\geq 2.58 \text{ mg/mL}$ (5.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.58 \text{ mg/mL}$（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.58 \text{ mg/mL}$ (5.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.58 \text{ mg/mL}$（饱和度未知）的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Suzuki E, et al. A novel small-molecule inhibitor of transforming growth factor beta type I receptor kinase (SM16) inhibits murine mesothelioma tumor growth in vivo and prevents tumor recurrence after surgical resection. Cancer Res. 2007 Mar 1;67(5):2351-9. [2]. Fu K, et al. SM16, an orally active TGF-beta type I receptor inhibitor prevents myofibroblast induction and vascular fibrosis in the rat carotid injury model. Arterioscler Thromb Vasc Biol. 2008 Apr;28(4):665-71. [3]. Engebretsen KV, et al. Attenuated development of cardiac fibrosis in left ventricular pressure overload by SM16, an orally active inhibitor of ALK5. J Mol Cell Cardiol. 2014 Nov;76:148-57.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80° C, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3229 mL	11.6144 mL	23.2288 mL	58.0720 mL
	5 mM	0.4646 mL	2.3229 mL	4.6458 mL	11.6144 mL
	10 mM	0.2323 mL	1.1614 mL	2.3229 mL	5.8072 mL
	15 mM	0.1549 mL	0.7743 mL	1.5486 mL	3.8715 mL
	20 mM	0.1161 mL	0.5807 mL	1.1614 mL	2.9036 mL
	25 mM	0.0929 mL	0.4646 mL	0.9292 mL	2.3229 mL
	30 mM	0.0774 mL	0.3871 mL	0.7743 mL	1.9357 mL
	40 mM	0.0581 mL	0.2904 mL	0.5807 mL	1.4518 mL
	50 mM	0.0465 mL	0.2323 mL	0.4646 mL	1.1614 mL
	60 mM	0.0387 mL	0.1936 mL	0.3871 mL	0.9679 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	80 mM	0.0290 mL	0.1452 mL	0.2904 mL	0.7259 mL
	100 mM	0.0232 mL	0.1161 mL	0.2323 mL	0.5807 mL



源叶