



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

产品名称: **LY-3200882**
CAS 号: **1898283-02-7**
产品货号: **S88531**

生物活性:

Description	LY3200882 是一种有效的, 高度选择性的, 具有 ATP 竞争性和口服活性的 TGF-β 受体 1 型 (ALK5) 抑制剂, IC50 为 38.2 nM. LY3200882 可抑制多种促肿瘤活性, 还用作免疫调节剂。				
IC50 & Target	IC50: 38.2 nM (TGF-β receptor type 1 (ALK5))[2]				
In Vitro	LY3200882 以剂量依赖性方式体外有效抑制肿瘤和免疫细胞中的 TGF β 介导的 SMAD 磷酸化[1]。 LY3200882 在三阴性乳腺癌的原位 4T1-LP 模型中表现出强大的抗肿瘤活性, 并且这种活性与肿瘤微环境中增强的肿瘤浸润淋巴细胞相关[1]。 在体外免疫抑制试验中, LY3200882 已显示出挽救 TGF β 1 抑制或 T 调节细胞抑制的幼稚 T 细胞活性并恢复增殖的能力[1]。 LY3200882 抑制 NIH3T3 细胞活力, IC50 为 82.9 nM[2]。				
In Vivo	LY3200882 (60 mg/kg; 口服管饲; 每日两次; 持续 21 天; BALB/C 雌性小鼠) 治疗可显著延缓 CT26 模型中的肿瘤生长[2]。 LY3200882 以剂量依赖性方式强效抑制皮下肿瘤中 TGF β 介导的 SMAD 磷酸化[1]。 LY3200882 在实验转移性肿瘤模型 (三阴性乳腺癌静脉注射 EMT6-LM2 模型) 中表现出体内抗转移活性[1]。				
	Animal Model:	BALB/C female mice (5-8-week-old) injected with CT26 cells[2]			
	Dosage:	60 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; twice a day; for 21 days			
	Result:	A statistically significant tumor growth delay in CT26 model was observed.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (76.53 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)				
	Solvent Mass Concentration Preparing Stock Solutions	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	2.2961 mL	11.4805 mL	22.9611 mL
		5 mM	0.4592 mL	2.2961 mL	4.5922 mL
		10 mM	0.2296 mL	1.1481 mL	2.2961 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 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 ddH₂O 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Huaxing Pei, et al. Abstract 955: LY3200882, a novel, highly selective TGFβRI small molecule inhibitor. AACR; Cancer Res 2017;77(13 Suppl):Abstract nr 955. [2]. Xu G, et al. Synthesis and biological evaluation of 4-(pyridin-4-oxy)-3-(3,3-difluorocyclobutyl)-pyrazole derivatives as novel potent transforming growth factor-β type 1 receptor inhibitors. Eur J Med Chem. 2020 Apr 29;198:112354.

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	2.2961 mL	11.4805 mL	22.9611 mL	57.4026 mL
	5 mM	0.4592 mL	2.2961 mL	4.5922 mL	11.4805 mL
	10 mM	0.2296 mL	1.1481 mL	2.2961 mL	5.7403 mL
	15 mM	0.1531 mL	0.7654 mL	1.5307 mL	3.8268 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

	20 mM	0.1148 mL	0.5740 mL	1.1481 mL	2.8701 mL
	25 mM	0.0918 mL	0.4592 mL	0.9184 mL	2.2961 mL
	30 mM	0.0765 mL	0.3827 mL	0.7654 mL	1.9134 mL
	40 mM	0.0574 mL	0.2870 mL	0.5740 mL	1.4351 mL
	50 mM	0.0459 mL	0.2296 mL	0.4592 mL	1.1481 mL
	60 mM	0.0383 mL	0.1913 mL	0.3827 mL	0.9567 mL



源叶