



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: **R-268712**
产品别名: **R-268712**

生物活性:

Description

R-268712 is a potent and selective inhibitor of ALK5 with an IC₅₀ of 2.5 nM. IC₅₀ value: 2.5 nM [1] Target: ALK5 in vitro: R-268712 is a novel and specific inhibitor of activin receptor-like kinase 5 (ALK5), a transforming growth factor β (TGF- β) type I receptor. R-268712 is a potent and selective inhibitor of ALK5 with an IC₅₀ of 2.5 nM, an approximately 5000-fold more selectivity for ALK5 than p38 mitogen-activated protein kinase (MAPK). R-268712 is a weak inhibitor of p38 MAP kinase (IC₅₀: 12.1 μ M).[1] in vivo: Oral administration of R-268712 at doses of 1, 3 and 10 mg/kg also inhibited the development of renal fibrosis in a dose-dependent manner in a unilateral ureteral obstruction (UUO) model. [1]

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 125 mg/mL (343.98 mM; Need ultrasonic)

	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM		2.7519 mL	13.7593 mL	27.5186 mL
	5 mM		0.5504 mL	2.7519 mL	5.5037 mL
	10 mM		0.2752 mL	1.3759 mL	2.7519 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, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 μ L 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE- β -CD in saline)

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。

3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil



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

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (5.72 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. 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.



源叶生物