

Vactosertib (TEW-7197)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Vactosertib (TEW-7197)	53507ES08	5 mg
	53507ES25	25 mg

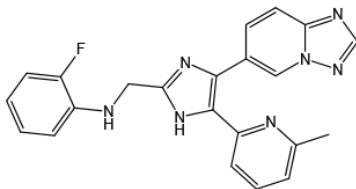
产品描述

Vactosertib (TEW-7197, TEW7197, EW-7197, EW7197), 是一种高效可口服的 TGF- β receptor 选择性抑制剂, 作用于 ALK4/5 的 IC₅₀ 分别为 13 nM 和 11 nM, 具有抗癌活性。TGF- β 受体在各种人类疾病中经常高表达, 如癌症以及自身免疫性疾病, 因此, TGF- β 信号通路可作为相关疾病的药物靶点。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Vactosertib, TEW-7197, TEW7197, EW-7197, EW7197
靶点 (Target)	ALK4/ALK5
通路 (Pathway)	TGF- β /Smad--TGF- β receptor
CAS 号 (CAS NO.)	1352608-82-2
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₁₈ N ₇
分子量 (Molecular Weight)	399.42
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 3 年。建议分装后-20℃干燥保存, 避免反复冻融。

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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)

在 HaCaT (3TP-luc) 和 4T1 (3TP-luc) 稳转细胞中, Vactosertib 有效抑制 TGF- β 1 诱导的荧光素酶报告基因活性, IC₅₀ 分别为 16.5 和 12.1 nM。^[1] 在 TGF β 处理的乳腺癌细胞中, EW-7197 (10-1000 nM) 抑制 TGF β 诱导的 Smad2 或 Smad3 磷酸化和上皮细胞到间叶细胞的转化(EMT)。此外, EW-7197 也会废除乳腺细胞中 TGF β 1 诱导的肿瘤细胞迁移和侵袭。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在大鼠体内, EW-7197 具有 51% 的口服生物利用度, 具有高全身接触剂量(AUC) 1426 ng×h/mL, 最高血浆浓度(C_{max}) 为 1620 ng/mL。EW-7197 也对心血管系统, 中枢神经系统, 和呼吸系统表现出低毒性。在小鼠 B16 黑色素瘤模型中, EW-7197 (2.5 mg/kg) 增强细胞毒性 T 淋巴细胞应答而抑制黑色素瘤生长。^[2] EW-7197 增强 4T1 原位移植小鼠体内的细胞毒性 T 淋巴细胞活性, 并增加 4T1-Luc 和 4T1 乳腺肿瘤小鼠的生存时间。^[3]

参考文献

- [1]. Jin CH, et al. Discovery of N-((4-([1,2,4]triazolo[1,5-a]pyridin-6-yl)-5-(6-methylpyridin-2-yl)-1H-imidazol-2-yl)methyl)-2-fluoroaniline (EW-7197): a highly potent, selective, and orally bioavailable inhibitor of TGF- β type I receptor kinase as cancer immunotherapeutic/antifibrotic agent. J Med Chem. 2014 May 22; 57(10):4213-38.
- [2]. Yoon JH et al. Activin receptor-like kinase5 inhibition suppresses mouse melanoma by ubiquitin degradation of Smad4, thereby derepressing comesodermin in cytotoxic T lymphocytes. EMBO Mol Med. 2013 Nov. 5(11):1720-39.
- [3]. Son JY et al. EW-7197, a novel ALK-5 kinase inhibitor, potently inhibits breast to lung metastasis. Mol Cancer Ther. 2014 Jul;13(7):1704-16.