

LY2157299 (LY-2157299; Galunisertib)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
LY2157299 (LY-2157299; Galunisertib)	52602ES08	5 mg
	52602ES10	10 mg

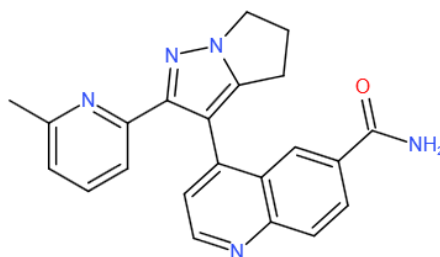
产品描述

LY2157299 是高效特异性的 TGF- β receptor I (TGF- β RI) 抑制剂 (T β RI 拮抗剂), 其 IC₅₀ 值为 56 nM。LY2157299 能有效抑制 TGF β 受体信号, 可用于评估对肝癌的抗肿瘤活性。LY2157299 可抑制 HUVEC 细胞中 TGF β 诱导的 Smad2 的磷酸化, 抑制肿瘤细胞增殖, 具有显著的抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	LY-2157299; LY 2157299; Galunisertib
中文名称 (Chinese Name)	4-[5,6-二氢-2-(6-甲基-2-吡啶基)-4H-吡咯并[1,2-b]吡唑-3-基]-6-喹啉甲酰胺
靶点 (Target)	TGF- β RI
CAS 号 (CAS NO.)	700874-72-2
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₁₉ N ₅ O
分子量 (Molecular Weight)	369.42
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥20 mg/mL

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 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）

LY2157299 (100 nM; 16 h) 处理 HLE 和 HLF 细胞，LY2157299 显著抑制 HLE 和 HLF 细胞在不同细胞外基质（ECM）上的迁移，抑制 p-SMAD2 的磷酸化。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

LY2157299（75 mg/kg；口服给药；2 次/天）处理移植了 Calu6 或 MX1 细胞的裸鼠，LY2157299 减少了 70% 的 p-SMAD 的磷酸化，表现出显著的抗肿瘤活性。^[2]

参考文献

- [1]. Dituri F, et al. Differential inhibition of the TGF- β signaling pathway in HCC cells using the small molecule inhibitor LY2157299 and the D10 monoclonal antibody against TGF- β receptor type II. *PloS one*, 2013, 8(6): e67109.
- [2]. Bueno L, et al. Semi-mechanistic modelling of the tumour growth inhibitory effects of LY2157299, a new type I receptor TGF- β kinase antagonist, in mice. *European journal of cancer*, 2008, 44(1): 142-150.