

LDN193189 Tetrahydrochloride

产品信息

产品名称	产品编号	规格
LDN193189 Tetrahydrochloride	53414ES08	5 mg

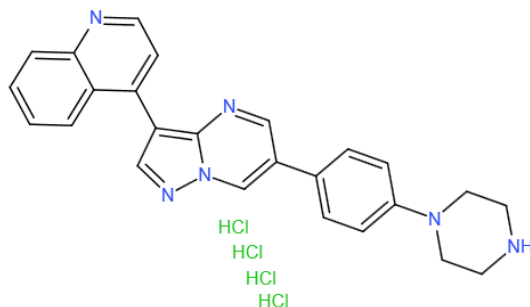
产品描述

LDN193189 Tetrahydrochloride 能有效抑制 BMP I 型受体 ALK2 和 ALK3 (IC₅₀ 分别为 5 nM 和 30 nM) 以及 TGF-β I 型受体 ALK4、ALK5 和 ALK7 (IC₅₀ ≥ 500 nM) 的转录活性, 并增加对 BMP 的选择性, 抑制 BMP4 介导的 Smad1、Smad5 和 Smad8 活化, 也能抑制 BMP4 对 C2C12 细胞中碱性磷酸酶活性的诱导, 影响 BMP 诱导的成骨细胞分化。

产品性质

靶点 (Target)	ACVRI; BMPRI1A
通路 (Pathway)	TGF-beta/Smad—TGF-β Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	2310134-98-4
分子式 (Formula)	C ₂₅ H ₂₆ Cl ₄ N ₆
分子量 (Molecular Weight)	552.33
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
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°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C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)

LDN193189 Tetrahydrochloride 抑制 BMP4 介导的 Smad1、Smad5 和 Smad8 活化, 比 dorsomorphin 更有效 (IC₅₀: 5 nM VS 470 nM), 同时对 BMP 通路的选择性与 TGF-β 通路相比保持 200 倍 (对 TGF-β 的 IC₅₀ ≥1000 nM)。LDN193189 Tetrahydrochloride 有效抑制 BMP I 型受体 ALK2 和 ALK3 (IC₅₀ 分别为 5 nM 和 30 nM) 以及 TGF-β I 型受体 ALK4、ALK5 和 ALK7 (IC₅₀ ≥500 nM) 的转录活性, 并增加对 BMP 的选择性。发现表明 LDN193189 可能影响 BMP 诱导的成骨细胞分化。事实上, 即使在 BMP 刺激后 12 小时给药, LDN193189 Tetrahydrochloride 也能抑制 BMP4 对 C2C12 细胞中碱性磷酸酶活性的诱导, 这表明成骨分化需要持续的 BMP 信号传导活性。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

植入肿瘤 7 天后, 每天两次腹腔注射 LDN193189 Tetrahydrochloride (3 mg/kg)。在前 5 周后, 对照载体和 LDN193189 Tetrahydrochloride 处理的小鼠之间的生长速率没有显著差异, 但在处理后 6、7 周后检测到生长速率的差异。肿瘤的 X 射线显示, 与对照组相比, LDN193189 Tetrahydrochloride 治疗组的肿瘤异位骨体积和骨密度降低。^[2] 来自肺动脉高压(PAH)大鼠的肺动脉平滑肌细胞(PASMCs)与 UK-92480 和 LDN193189 Tetrahydrochloride 共孵育完全抑制骨形态发生蛋白(BMPR2)和 Cx40 的抗增殖和上调。^[3]

参考文献

- [1]. Yu PB, et al. BMP type I receptor inhibition reduces heterotopic [corrected] ossification. *Nat Med*, 2008, 14(12), 1363-1369.
- [2]. Lee YC, et al. BMP4 promotes prostate tumor growth in bone through osteogenesis. *Cancer Res*, 2011, 71(15), 5194-5203.
- [3]. Yang L, et al. UK-92480 increases connexin 40 in smooth muscle cells through activation of BMP pathways in pulmonary arterial hypertension. *Int J Clin Exp Pathol*. 2014 Jul 15;7(8):4674-84.