

HB211213

## LDN193189 (DM-3189)

## 产品信息

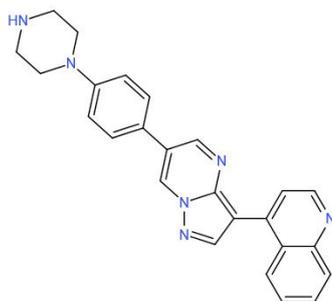
| 产品名称                | 产品编号      | 规格    |
|---------------------|-----------|-------|
| LDN193189 (DM-3189) | 53012ES08 | 5 mg  |
|                     | 53012ES10 | 10 mg |

## 产品描述

LDN193189 (DM-3189) 是一种高效选择性的 BMP (转录活性形态发生蛋白) 信号通路抑制剂, 抑制 BMP I 型受体 ALK2 (活化素受体样激酶-2) 和 ALK3 (活化素受体样激酶-3) 的转录活性, 其 IC<sub>50</sub> 值分别为 5 nM 和 30 nM。

## 产品性质

|                        |   |
|------------------------|---|
| 英文别名 (English Synonym) | LDN-193189; DM3189; 6-(4-(2-(piperidin-1-yl)ethoxy)phenyl)-3-(pyridin-4-yl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidine; LDN 193189; DM 3189 |
| 中文名称 (Chinese Name)    | 4-[6-(4-(哌嗪-1-基)苯基)吡唑并[1,5-A]嘧啶-3-基]喹啉  |
| 靶点 (Target)            | ALK2; ALK3  |
| CAS 号 (CAS NO.)        | 1062368-24-4  |
| 分子式 (Formula)          | C <sub>25</sub> H <sub>22</sub> N <sub>6</sub>  |
| 分子量 (Molecular Weight) | 406.48  |
| 外观 (Appearance)        | 粉末  |
| 纯度 (Purity)            | ≥98%  |
| 溶解性 (Solubility)       | Ethanol: 1 mg/mL (2.46 mM); DMSO: <1mg/mL (不溶或微溶), 需超声处理  |
| 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。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）

LDN193189 抑制 BMP4 介导的 Smad1、Smad5、Smad8 的活化，其活性（IC<sub>50</sub>: 5 nM）比背索吗啡（IC<sub>50</sub>: 470 nM）强，同时保留了 200 倍 BMP 信号传导对转化生长因子-β（TGF-β）信号传导的选择性。LDN193189 有效抑制 BMP I 型受体 ALK2 和 ALK3 的转录活性（IC<sub>50</sub> 分别为 5 nM 和 30 nM），对激活素和 TGF-β I 型受体 ALK4、ALK5、ALK7 的作用明显减弱（IC<sub>50</sub> ≥ 500 nM）。结果表明，LDN193189 可能会影响 BMP 诱导的成骨细胞分化。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

LDN193189（3 mg/kg，腹腔注射）单次给药 C57BL/6 小鼠后测量了其血浆浓度，评估其药代动力学水平。LDN193189 保持高于其体外 IC<sub>50</sub> 几倍的水平，时间 > 8 h，这表明通过给药可以持续抑制 BMP 信号传导。为了评估 ALK2 激酶抑制作用对体内异位钙化的影响，LDN-193189（3 mg/kg，腹腔注射）每 12 小时处理 Ad.Cre 条件性 caALK2 转基因小鼠和野生型小鼠，结果显示 LDN193189 会导致附近的左胫骨和腓骨在 P13 处出现轻度钙化。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Yu P B, et al. BMP type I receptor inhibition reduces heterotopic ossification[J]. Nature Medicine, 2008, 14(12):1363-1369.
- [2]. Ranadive I, et al. Evaluation of multikinase inhibitor LDN193189 induced hepatotoxicity in teleost fish *Poecilia latipinna*[J]. Drug & Chemical Toxicology, 2018:1.
- [3]. Cannon JE, et al. Intersegmental vessel formation in zebrafish: requirement for VEGF but not BMP signalling revealed by selective and non-selective BMP antagonists. Br J Pharmacol. 2010 Sep;161(1):140-9.