

HB220113

LY2109761 (LY-2109761)

产品信息

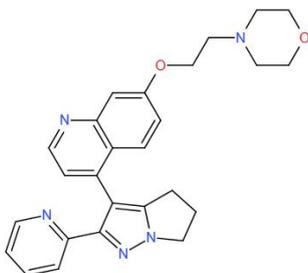
产品名称	产品编号	规格
LY2109761 (LY-2109761)	52605ES08	5 mg
	52605ES10	10 mg

产品描述

LY2109761 (LY-2109761; LY 2109761) 是一种 TGF- β 受体 I/II 型激酶的小分子抑制剂 ($IC_{50} = 69$ nM)。已用于研究 TGF- β 信号通路在胰腺癌细胞系肿瘤细胞迁移和转移过程中的作用, 其中 5 μ M 的化合物能完全破坏 Smad-2 磷酸化, 其是激酶的一种直接作用的下游靶点。它还可以抑制人原代纤维细胞中辐射诱导的炎性细胞因子信号传导和促血管生成基因, 包括 ID1。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	4-[5,6-dihydro-2-(2-pyridinyl)-4H-pyrrolo[1,2-b]pyrazol-3-yl]-7-[2-(4-morpholinyl)ethoxy]-quinolinel; LY 2109761
中文名称 (Chinese Name)	4-[5,6-二氢-2-(2-吡啶)-4H-吡咯并[1,2-b]吡唑-3-基]-7-[2-(4-吗啉)乙氧基]喹啉
靶点 (Target)	T β RI; T β RII
CAS 号 (CAS NO.)	700874-71-1
分子式 (Formula)	C ₂₆ H ₂₇ N ₅ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	441.52
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥ 22.1 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）

LY2109761 (4 μ M; 24 h) 作用于人 MDA PCa 2b、PC-3 细胞系，在 rhTGF- β 1 处理的 MDA PCa 2b 细胞、PC-3 细胞中，TGF- β 1 诱导 PC-3 和 PMOs，而非 MDA PCa 2b 细胞中 Smad2 的磷酸化。LY2109761 抑制 PC-3 和 PMOs 细胞中 TGF- β 1 诱导的 Smad2 的激活。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

LY2109761 (200 mg/kg/day; 口服给药) 处理雄性 SCID 小鼠，3 周后，实验组比对照组有明显更小的肿瘤体积。LY2109761 抑制 PC-3 诱导的破骨细胞的活化。^[1]

参考文献

- [1]. Wan X, et al. Effect of transforming growth factor beta (TGF- β) receptor I kinase inhibitor on prostate cancer bone growth[J]. Bone, 2012, 50(3): 695-703.
- [2] Melisi, et al. LY2109761, a novel transforming growth factor β receptor type I and type II dual inhibitor, as a therapeutic approach to suppressing pancreatic cancer metastasis. Molecular Cancer Therapeutics 7(4), 829-840 (2008).
- [3] Flechsig, P., et al. LY2109761 attenuates radiation-induced pulmonary murine fibrosis via reversal of TGF- β and BMP-associated proinflammatory and proangiogenic signals. Clinical Cancer Research 18(13), 3616-3627 (2012).