

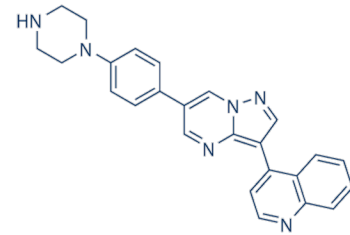
LDN193189 (BMP/TGF-β/Smad抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF7912-1mM	LDN193189 (BMP/TGF-β/Smad抑制剂)	1mM×2ml
SF7912-5mg	LDN193189 (BMP/TGF-β/Smad抑制剂)	5mg
SF7912-25mg	LDN193189 (BMP/TGF-β/Smad抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-(5-chloro-2-fluorophenyl)-N-pyridin-4-ylpteridin-4-amine
简称	LDN193189
别名	ALK5 Inhibitor V
中文名	N/A
化学式	C ₂₅ H ₂₂ N ₆
分子量	406.48
CAS号	1062368-24-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 5mg/ml warming; DMSO 5mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入12.3ml DMSO, 或每4.06mg加入10ml DMSO, 配制成1mM溶液。SF7912-1mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	LDN-193189是一种选择性的BMP信号通路抑制剂, 抑制BMP I型受体ALK2和ALK3的转录活性, 在C2C12细胞中IC50分别为5nM和30nM, 作用于BMP比作用于TGF-β选择性高200倍。				
信号通路	TGF-beta/Smad; Stem Cells & Wnt				
靶点	ALK2	ALK3	—	—	—
IC50	5nM	30nM	—	—	—
体外研究	LDN193189有效抑制BMP4介导的Smad1、Smad5和Smad8活化, IC50为5nM, 并有效地抑制BMP的I型受体ALK2和ALK3的转录活性, IC 50分别为5nM和30nM。此外, LDN193189还抑制组成型活性ALK2R206H或ALK2Q207D突变蛋白诱导的转录活性。最近的一项研究表明在动脉粥样硬化形成的人主动脉内皮细胞中, LDN-193189阻止氧化低密度脂蛋白诱导的活性氧生成。				
体内研究	在利用Ad.Cre条件性caALK2转基因小鼠中, 与对7日龄(P7), LDN-193189(3mg/kg,腹腔注射)导致邻近的左胫骨和腓骨在P13出现轻度钙化, 并防止在P15出现放射线病变而不会造成体重减轻或生长迟缓, 自发性骨折, 骨质密度下降或行为异常。LDN193189通过抑制骨形态发生蛋白(BMP)6诱导的信号转导途径而斑马鱼胚胎背部化, 而对血管发育无影响。在含Pca-118b瘤小鼠中, LDN-193189削弱肿瘤生长并降低了肿瘤中的骨形成。在低密度脂蛋白受体缺陷(LDLR-/-)小鼠中, LDN-193189有效地抑制动脉粥样硬化的发展。此外, LDN-193189也表现出对相关的血管炎, 成骨活性和钙化的抑制作用。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	C2C12细胞以每孔2000个细胞接种到96孔板中, 培养基是含有2% FBS的DMEM。4孔重复中加入BMP配体和LDN-193189或对照。经过在50μl Tris缓冲盐水和1%的Triton X-100中培养6天后收集细胞。细胞裂解物中加入对-硝基-苯基磷酸酯试剂在96孔板中反应1小时, 然后检测碱性磷酸酶活性(吸光度在405nm处)。细胞活力和数量是由细胞滴定水性单(490nm处的吸光度)进行测定, 复孔处理方法和碱性磷酸酶测量一致。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A

处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	Ad.Cre在第7天注射到条件caALK2-转基因鼠和正常鼠中。
配制	LDN193189溶解在DMSO中并用水稀释。
剂量	小于等于3mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

1. Yu PB, et al. Nat Med, 2008, 14(12), 1363-1369.
2. Cannon JE, et al. Br J Pharmacol, 2010, 161(1), 140-149.
3. Lee YC, et al. Cancer Res, 2011, 71(15), 5194-5203.
4. Derwall M, et al. Arterioscler Thromb Vasc Biol, 2012, 32(3), 613-622.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF7912-1mM	LDN193189 (BMP/TGF- β /Smad抑制剂)	1mM \times 2ml
SF7912-5mg	LDN193189 (BMP/TGF- β /Smad抑制剂)	5mg
SF7912-25mg	LDN193189 (BMP/TGF- β /Smad抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于1mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.05.16