

## LDN-193189 2HCl

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
LDN-193189 2HCl	53588ES08	5 mg

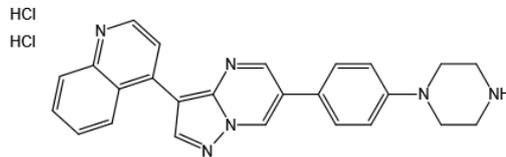
### 产品描述

LDN-193189 (LDN193189, DM3189, DM-3189) 2HCl, 是一种选择性 BMP 信号抑制剂, 抑制 ALK1/2/3/6, IC<sub>50</sub> 分别为 0.8 nM、0.8 nM、5.3 nM 和 16.7 nM。LDN-193189 已被用于研究进行性骨化性纤维发育不良的发病机制、先天性骨化障碍和骨形成在前列腺肿瘤骨转移中的作用。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	LDN-193189 2HCl, DM-3189 2HCl, DM3189 2HCl, LDN193189 2HCl
靶点 (Target)	ALK1/2/3/6
通路 (Pathway)	TGF-β/Smad--TGF-β Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	1435934-00-1
分子式 (Formula)	C <sub>25</sub> H <sub>24</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>6</sub>
分子量 (Molecular Weight)	479.4
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 H <sub>2</sub> O

### 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 能有效抑制 BMP4 介导的 Smad1/5/8 激活, IC<sub>50</sub> 是 5 nM, 也能有效抑制 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。此外, LDN193189 对持续性激活的 ALK2<sup>R206H</sup> 或者 ALK2<sup>Q207D</sup> 突变蛋白诱导的转录激

活也具有抑制作用。<sup>[1]</sup> 在人动脉内皮细胞中, LDN-193189 阻断由氧化的 LDL 诱导的氧化自由基的产生。<sup>[4]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

在携带 Ad.Cre 的条件性 caALK2 转基因小鼠出生后 7 天, 腹腔注射 LDN-193189 (3 mg/kg) 在第 13 天引起微弱的左胫骨和腓骨钙化, 在第 15 天阻断病变, 同时不引起体重降低或者生长迟滞, 自发骨折, 降低骨密度或者行为异常。<sup>[1]</sup> LDN193189 通过抑制骨形态生成蛋白 BMP6 诱导的信号通路促进弯曲的斑马鱼胚胎形成, 但不影响对血管发育。<sup>[2]</sup> 在 PCa-118b 移植瘤小鼠模型中, 给药 LDN-193189 显著抑制肿瘤生长, 降低肿瘤中的骨形成。<sup>[3]</sup> 在 LDLR<sup>-/-</sup>小鼠中, LDN-193189 抑制动脉粥样化的发展。此外, LDN-193189 具有对血管炎症, 成骨活性和钙化的抑制作用。<sup>[4]</sup>

## 参考文献

- [1]. Yu PB, et al. BMP type I receptor inhibition reduces heterotopic [corrected] ossification. *Nat Med.* 2008 Dec;14(12):1363-9.
- [2]. 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.
- [3]. Lee YC, et al. BMP4 promotes prostate tumor growth in bone through osteogenesis. *Cancer Res.* 2011 Aug 1;71(15):5194-203.
- [4]. Derwall M, et al. Inhibition of bone morphogenetic protein signaling reduces vascular calcification and atherosclerosis. *Arterioscler Thromb Vasc Biol.* 2012 Mar;32(3):613-22.