

产品名称: LDN193189 (Hydrochloride)

产品别名: LDN-193189 HCl

生物活性:					
Description	LDN193189 HCl 是 LDN193189 的盐酸盐, 是一种选择性 BMP 信号抑制剂, 它能抑制 BMP type I receptors ALK2 和 ALK3 的转录活性, 在 C2C12 细胞中 IC50 分别为 5 nM 和 30 nM, 并且对于 BMP 的选择性是对 TGF-β 选择性的 200 倍。				
IC ₅₀ & Target	ALK2 [1] (C2C12 cells)	ALK3 [1] (C2C12 cells)			
	5 nM	30 nM			
In Vitro	LDN193189 能有效抑制 BMP4 介导的 Smad1, Smad5 and Smad8 激活, IC50 是 5 nM, 也能有效抑制 BMP I 型受体 ALK2 和 ALK3 的转录活性, IC50 分别为 5nM 和 30 nM。此外, LDN193189 对持续性激活的 ALK2R206H 或者 ALK2Q207D 突变蛋白诱导的转录激活也具有抑制作用。[1]最近的一项研究表明, 在动脉内皮细胞中, LDN-193189 阻断由氧化的 LDL 诱导的氧化自由基的产生。[4]				
In Vivo	在携带 Ad.Cre 的条件性 caALK2 转基因小鼠出生后 7 天, LDN-193189 (3 毫克/千克, 腹腔注射)引起微弱的左胫骨和腓骨钙化, 在第 13 天可见, 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。[1]LDN193189 通过抑制骨形态生成蛋白(BMP)6 诱导的信号通路形成弯曲的斑马鱼胚胎, 同时, 对血管发育没有影响。[2]在有 PCa-118b 肿瘤的小鼠体内, LDN-193189 处理减慢肿瘤生长, 降低肿瘤中的骨形成。[3]在 LDLR-/-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。[4]				
实验参考:					
Animal Administration	Animal Model:	产后第 7 天注射 Ad.Cre 的 caALK2 转基因型和野生型小鼠。			
	Dosage:	≤3 毫克/千克			
	Administration:	通过腹腔注射给药			
	Formulation:	LDN193189 溶解于 DMSO, 随后在水中稀释。			
Solvent&Solubility	In Vitro:				
	DMSO : Insoluble				
	Water: 52 mg/mL (108.46 mM)				
	Preparing Stock Solutions	<div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0859 mL	10.4297 mL	20.8594 mL
		5 mM	0.4172 mL	2.0859 mL	4.1719 mL
		10 mM	0.2086 mL	1.0430 mL	2.0859 mL
50 mM		0.0417 mL	0.2086 mL	0.4172 mL	
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。					
储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。					
References	<p>[1] Yu PB, et al. Nat Med, 2008, 14(12), 1363-1369.</p> <p>[2] Cannon JE, et al. Br J Pharmacol, 2010, 161(1), 140-149.</p> <p>[3] Lee YC, et al. Cancer Res, 2011, 71(15), 5194-5203.</p> <p>[4] Derwall M, et al. Arterioscler Thromb Vasc Biol, 2012, 32(3), 613-622.</p>				