

Catalog Number: CM04861

产品信息

Catalog Number:
CM04861

CAS号:
1589527-65-0

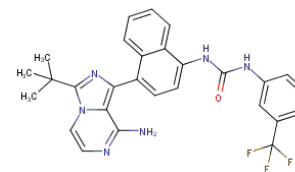
分子式:
 $C_{28}H_{25}F_3N_6O$

主要靶点:
IRE1

主要通路:
细胞周期

分子量:
518.53

溶解度:
DMSO: 5 mg/mL (9.64 mM); Ethanol: 2 mg/mL (3.86 mM)



靶点活性

IRE1 α : 0.6 μ M (cell free)

体外活性

KIRA6 (10-1000 nM, 72小时) 在低纳摩尔浓度下显著影响依赖KIT的细胞系HMC-1.1的活性, 这种作用与KIT阻断一致。KIRA6 (1nM-100 μ M) 与KIT的细胞质域结合, K_d 值为10.8 μ M。KIRA6 (10-1000 nM, 1小时) 降低了KIT的信号输出, 包括KIT的磷酸化以及其下游信号模块PSTAT5和磷酸化的ERK1/2 [1]。KIRA6 (1 μ M, 0-48小时) 以剂量依赖的方式抑制IRE1 α 过度激活导致的Ins1 mRNA降解。KIRA6 (0.1-10 μ M, 72小时) 以剂量依赖的方式减少1NM-PP1在内质网应激期间增强的Ins1凋亡 [2]。

体内活性

KIRA6 (腹腔注射: 5 mg/kg; 37天) 与自由饮食的对照组相比, 在几周内显著改善了随机葡萄糖水平。在停止注射后, KIRA6 (i.p, 5 mg/kg, 注射后21或18天) 在秋田鼠[2]中能显著提高血浆胰岛素和C-肽水平, 保持胰岛阳性岛区域在高水平。

动物实验

Animal Model: Male Ins2+/Akita mice. Dosage: 5 mg/kg. Administration: Intraperitoneal injection, 5 mg/kg, 21 or 18 days post injections [2]

细胞实验

Cell Line: HMC-1.1 cells. Concentration: 10 nM, 30 nM, 100 nM, 300 nM, 1000 nM. Incubation Time: 72 hours [1]

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.