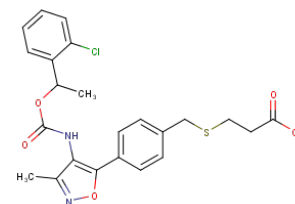


Catalog Number: CM04977

产品信息

Catalog Number:
CM04977CAS号:
355025-24-0分子式:
C₂₃H₂₃ClN₂O₅S主要靶点:
LPL Receptor|LPA Receptor主要通路:
G 蛋白偶联受体|G 蛋白偶联受体分子量:
474.96溶解度:
DMSO:94 mg/mL (197.91
mM);H₂O:< 1 mg/mL (insoluble
or slightly soluble);Ethanol:84
mg/mL (176.9 mM)

靶点活性

LPA3:0.93 μ M(Ki)|LPA2:6.5 μ M(Ki)|LPA1:0.34 μ M(Ki)

体外活性

Ki16425主要抑制LPA1和LPA3介导的反应，但对LPA2的影响较为适中。在THP-1细胞、3T3成纤维细胞和A431细胞中，Ki16425能够抑制由LPA引起的Ca(2+)反应，但在PC-12细胞和HL-60细胞中的影响较小，这表明Ki16425似乎是评估特定LPA受体在LPA短期反应中作用的有用工具。Ki16425能够抑制由LPA在Swiss 3T3成纤维细胞中诱导的长期DNA合成和细胞迁移。[1] Ki16425减少了LPA诱导的p42/p44促分裂原激活蛋白激酶（MAPK）激活，同时自身作为p42/p44 MAPK的弱刺激剂，这是典型的蛋白质激动剂特性。Ki16425还显著减少了NGF对p42/p44 MAPK的刺激作用，并抑制了NGF在PC-12细胞中诱导的神经突起生长。[2] Ki16425显著抑制了滑膜液诱导的COX-2蛋白表达。LPA增强IL-1作用对COX-2表达的影响也被Ki16425抑制。[3]

体内活性

Ki-16425 (30 mg/kg, i.p.) 在注射溶磷脂酸30分钟前给药时，能完全阻断由LPA引起的神经病理性疼痛样行为，而在90分钟前给药则无效，这表明Ki-16425是一种短效抑制剂。Ki-16425还能抑制神经损伤引起的背根神经节中Ca α 2 δ -1的上调和脊髓背角SP免疫反应性的减少。[4]

储存

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