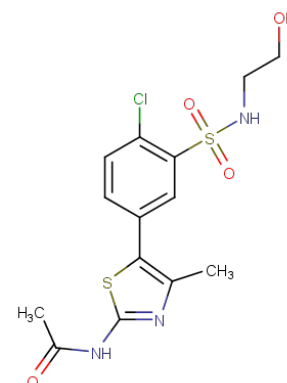


Catalog Number: CM05985

产品信息

Catalog Number:
CM05985分子量:
389.88CAS号:
593960-11-3溶解度:
DMSO:39 mg/mL (100 mM)分子式:
 $C_{14}H_{16}ClN_3O_4S_2$ 主要靶点:
ATM/ATR|DNA-PK|Carbonic
Anhydrase|PI4K|PI3K|HSV|mTOR|Virus
Protease主要通路:
微生物学|PI3K/Akt/mTOR信号通
路|DNA损伤和修复|代谢

靶点活性

PI3K α :39 nM|PI4K:19 nM

体内活性

0.5 μ M-1 μ M PIK-93作用于分化的HL60细胞,损害用f-Met-Leu-Phe处理而形成的聚集的稳定性。在COS-7细胞中,PIK-93 (250 nM) 有效地消除了高尔基体中CERT-PH结构域和FL-Cer的积累。在T6.11细胞中,300 nM PIK-93降低Carbachol诱导的TRPC6移位到质膜上和Ca²⁺进入。相同浓度PIK-93也明显抑制[³H]丝氨酸标记的内源性神经酰胺转变为神经鞘磷脂。这些说明了PI4KIII β 在内质网和高尔基体中的神经酰胺转移时具有重要作用,以及有效调节鞘磷脂的合成。一项研究显示,PIK-93具有抗肠道病毒功能,抑制脊髓灰质炎病毒和丙型肝炎病毒复制,EC₅₀分别为0.14 μ M和1.9 μ M。PIK-93有效抑制PI3K γ 和PI4KIII β , IC₅₀分别为16 nM和19 nM。PIK-93也抑制其他PI3Ks成员,包括PI3K α , β 和 δ , IC₅₀分别为39 nM,0.59 μ M和0.12 μ M。而PIK-93对其他激酶几乎没有抑制效果,即使浓度为10 μ M。

细胞实验

For actin staining, dHL60 cells are preincubated in suspension with PIK-93 or vehicle for 40 min, centrifuged for 5 min at 2000 rpm at room temperature in a J6-B centrifuge, resuspended in mHBSS containing the respective agent at the same concentration, allowed to stick to fibronectin-covered coverslips, and subjected to stimulation with a uniform concentration of 100 nM f-Met-Leu-Phe (fMLP) for 3 min. Cells are fixed in 3.7% PFA and stained with 10 units/mL rhodamine-phalloidin for 15 min.(Only for Reference)

描述

PIK-93 is the first potent, synthetic PI4K inhibitor with IC₅₀ of 19 nM; inhibits PI3K α with IC₅₀ of 39 nM.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years