

Catalog Number: CM05998

产品信息

Catalog Number:
CM05998

CAS号:
438190-29-5

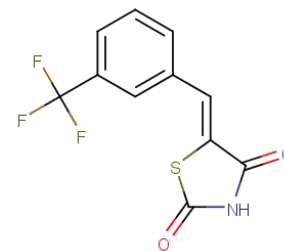
分子式:
 $C_{11}H_6F_3NO_2S$

主要靶点:
Pim

主要通路:
表观遗传|JAK/STAT信号通路

分子量:
273.23

溶解度:
DMSO:27.3 mg/mL (100 mM), Ethanol:27.3 mg/mL (100 mM)



靶点活性

Pim1:21 nM

体外活性

口服SMI-4a后1小时,与对照组小鼠肿瘤相比,p70 S6K磷酸化减少,而总的p70 S6K表达不变.每天60 mg/kg SMI-4a处理两次,明显降低肿瘤尺寸,且具有良好的耐受性.

体内活性

5 μ M SMI-4a抑制胰腺癌和白血病细胞生长。SMI-4a降低前列腺和造血细胞中Pim靶点的磷酸化。SMI-4a引起细胞周期停滞并逆转Pim-1的抗凋亡活性。SMI-4a是Pim1的ATP竞争性抑制剂,IC50为17 nM。SMI-4a显示Pim1对一组激酶具有高选择性。SMI-4a抑制已知底物即翻译阻遏物4E-BP1的Pim-1的体外磷酸化。SMI-4a增加细胞核中p27Kip1的量。SMI-4a处理诱导MAPK通路上调。SMI-4a处理pre-T-LBL抑制mTOR通路。

描述

(Z)-SMI-4a is a selective ATP-competitive Pim-1 kinase inhibitor with an IC50 of 21 nM.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year