

Catalog Number: CM06332

产品信息

Catalog Number:
CM06332

CAS号:
864082-47-3

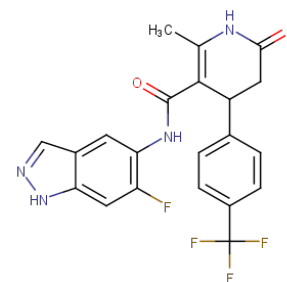
分子式:
C₂₁H₁₆F₄N₄O₂

主要靶点:
ROCK

主要通路:
细胞骨架|细胞周期|干细胞

分子量:
432.37

溶解度:
DMSO:81 mg/mL (187.3
mM), Ethanol:4 mg/mL (9.25
mM), H₂O:<1 mg/mL



靶点活性

ROCK1:14 nM|ROCK2:63 nM

体外活性

GSK429286A (3-30 mg/kg.p.o.) 剂量依赖性显著降低自发性高血压大鼠的平均动脉压, GSK429286A (30 mg/kg) 处理约2 h后, 最大降低50 mmHg.在雄性Sprague-Dawley大鼠体内,GSK429286A的口服生物利用度为61%.

体内活性

GSK429286A (1 μM) 可使ROCK2活性降低20倍,该浓度下仅有MSK1的活性降低了约5倍.与ROCK常用抑制剂Y-27632相比,GSK429286A是选择性更高的ROCK2抑制剂,即使30 μM对LRRK2也无明显抑制,IC₅₀比ROCK2的高500倍.与GSK269962A相同,在HEK-293细胞中,GSK429286A (10 μM) 可消除基底或G14V-Rho突变体诱导的MYPT Thr850上的磷酸化作用,效果与H-1152和Y-27632相似,与ROCK介导的磷酸化一致,G14V-Rho是否存在,GSK429286A均不影响ERM蛋白磷酸化. GSK429286A对RSK (IC₅₀: 0.78 μM) 和p70S6K (IC₅₀: 1.94 μM) 也有轻度抑制. GSK429286A对大鼠主动脉环扩张有显著抑制 (IC₅₀: 190 nM) 。

描述

GSK429286A is a specific inhibitor of ROCK1/2 (IC₅₀: 14/63 nM).

储存

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