

Catalog Number: CM06595

产品信息

Catalog Number:
CM06595

CAS号:
841290-80-0

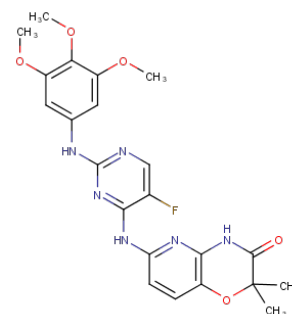
分子式:
 $C_{22}H_{23}FN_6O_5$

主要靶点:
Apoptosis|FLT|Syk

主要通路:
血管生成|凋亡|蛋白酪氨酸激酶

分子量:
470.45

溶解度:
H₂O:<1 mg/mL,DMSO:20 mg/mL
(42.5 mM),Ethanol:<1 mg/mL



靶点活性

Syk:41 nM

体外活性

R406口服给药患免疫复合物导致炎症反应的小鼠,明显抑制皮肤反向被动Arthus反应,1 mg/kg和5 mg/kg R406处理,与对照组相比则抑制分别为72%和86%。用10 mg/kg R406处理用胶原抗体处理的小鼠,明显减少炎症和肿胀,将进行性关节炎降低至最低水平,且延迟K/BxN血清转移小鼠模型发病,降低临床关节炎达50%。

体内活性

1 μM或4 μM R406处理DLBCL细胞系,诱导caspases 9和3激活,而不激活caspase 8,导致大部分细胞凋亡。R406在不同细胞中,选择性抑制Syk依赖的信号通路,EC₅₀为33 nM到171 nM,比作用于Syk非依赖性通路效果好很多。R406抑制大型弥漫性B细胞淋巴瘤(DLBCL)细胞系的细胞增殖,EC₅₀值范围为0.8 μM至8.1 μM。R406的预处理在B细胞受体(BCR)交联后完全阻断SYK525/526的磷酸化和R406敏感的DLBCL中SYK依赖性磷酸化BLNK。R406处理24和48小时后,有效降低MMP-9 mRNA水平,比对照组分别降低2.8和4.3倍,并降低RL细胞侵袭能力。

细胞实验

DLBCL cell lines are treated with serial dilutions of R406 (0.3, 0.6, 1.25, 2.5, or 5 μM) for 72 or 96 hours. Thereafter, cellular proliferation is determined by MTT assay, and cell apoptosis is assessed by using annexin V-FITC/propidium iodide (PI) staining. For the determination of caspase 9, 8, and 3, cells are lysed, size-fractionated by polyacrylamide gel electrophoresis (PAGE), and immunoblotted. (Only for Reference)

描述

R406 (free base) is a potent Syk inhibitor.

储存

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