

Catalog Number: CM06629

产品信息

Catalog Number:
CM06629

CAS号:
396129-53-6

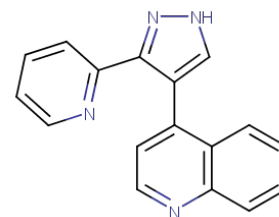
分子式:
C₁₇H₁₂N₄

主要靶点:
MLK|Casein Kinase|RIP
kinase|TGF-beta/Smad

主要通路:
干细胞|MAPK信号通路|代谢|NF-
κB信号通路|凋亡

分子量:
272.3

溶解度:
DMSO:27.2 mg/mL (100 mM)



靶点活性

TGF β RI:59 nM|MLK-7K:1.4 μM|TGF β RII:0.4 μM|CK1 δ:0.22 μM|RIPK2:0.11 μM

体外活性

1 mg/kg i.p. LY364947在BxPC3胰腺癌细胞的肿瘤异种移植模型中,明显增加肿瘤组织中LYVE-1-阳性区域.25 mg/kg i.p. LY364947在慢性腹膜炎小鼠模型中,明显增加的LYVE-1-阳性区域表明其加速淋巴管生成.Y364947 (25 mg/kg)可增加CML感染小鼠中白血病起始细胞中的p-Akt和减少核Foxo3a.

体内活性

在浓度低至0.25 μM时,LY364947使NMuMg细胞中的xVent2-lux BMP4响应增强30%。2 μM LY364947防止NMuMg细胞中TGF-β诱导的上皮-间质转化。3 μM LY364947处理24小时后,几乎在所有HDLCS中诱导Prox1和LYVE-1表达。LY364947促进Foxo3a的核输出,在白血病阳性细胞中具有低Smad2/3和高Akt磷酸化水平。与OP-9基质细胞共培养后,LY364947 (<20 μM)抑制白血病起始细胞集落形成能力。LY364947作为一种ATP竞争性,紧密结合抑制剂,通过TGF β R-I激酶抑制P-Smad3磷酸化,Ki为28 nM。LY364947抑制体内Smad2磷酸化,NMuMg细胞中IC50为135 nM。LY364947抑制NMuMg细胞内的体内Smad2磷酸化,IC50为135 nM。

描述

LY-364947 (HTS466284) is a potent ATP-competitive inhibitor of TGF β R-I.

储存

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