

GSK429286A

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53085ES08	5 mg
GSK429286A	53085ES10	10 mg
	53085ES50	50 mg

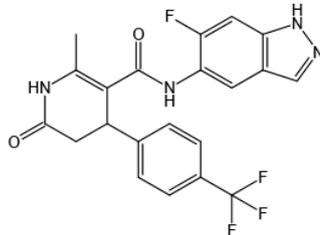
产品描述

GSK429286A (RHO-15, RHO15, GSK-429286A)是细胞通透性、选择性 ROCK1/2 强效小分子抑制剂, IC₅₀ 值分别为 14 nM 和 63 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GSK429286A, GSK-429286A, RHO-15, RHO15
中文名称 (Chinese Name)	N-(6-氟-1H-吲唑-5-基)-2-甲基-6-氧代-4-[4-(三氟甲基)苯基]-1,4,5,6-四氢-3-吡啶甲酰胺
靶点 (Target)	ROCK1/2
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage--ROCK
CAS 号 (CAS NO.)	864082-47-3
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₁₆ F ₄ N ₄ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	432.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥ 98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

GSK429286A 轻度抑制 RSK 和 p70S6K, IC_{50} 分别为 0.78 μ M 和 1.94 μ M。GSK429286A 显著抑制大鼠主动脉环扩张, IC_{50} 为 190 nM。^[1] GSK429286A (1 μ M) 导致 ROCK2 活性降低 20 倍, 其它被显著抑制的激酶只有 MSK1, 其活性减低了 5 倍。与 Y-27632 相比, GSK429286A 对 ROCK2 选择性更高, 即使在 30 μ M 的高剂量下也不显著抑制 LRRK2 (IC_{50} 比对 ROCK2 高 500 倍)。在 HEK-293 细胞中, GSK429286A (10 μ M) 消除基底或 G14V-Rho 突变体诱导的 MYPT Thr850 磷酸化。无论 G14V-Rho 是否存在, GSK429286A 均不抑制 ERM 蛋白磷酸化。^[2]

(二) 动物实验 (体内实验)

在雄性 Sprague-Dawley 大鼠体内, GSK429286A 具有 61% 的口服生物利用度。口服 GSK429286A (3-30 mg/kg 单剂量) 显著降低自发性高血压大鼠的平均动脉压, 30 mg/kg 剂量治疗大约 2 h 后, 最大降低 50 mmHg。^[1]

参考文献

- [1]. Goodman KB, et al. Development of dihydropyridone indazole amides as selective Rho-kinase inhibitors. *J Med Chem.* 2007 Jan 11;50(1):6-9.
- [2]. Nichols RJ, et al. Substrate specificity and inhibitors of LRRK2, a protein kinase mutated in Parkinson's disease. *Biochem J.* 2009 Oct 23;424(1):47-60.