

CMPD101

产品信息

产品名称	产品编号	规格
CMPD101	53086ES03	1 mg
	53086ES08	5 mg

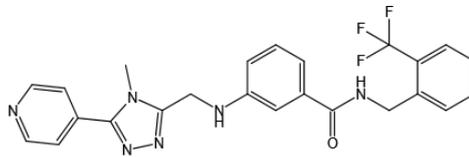
产品描述

CMPD101 (CMPD-101)是一种新型高效膜透性 GRK2/3 的小分子抑制剂, IC₅₀ 值分别为 18 nM 和 5.4 nM, 常用于研究心衰疾病。CMPD101 作用于 ROCK-2 和 GRK1/5 的选择性较小, IC₅₀ 值分别为 1.4 μM、3.1 μM、2.3 μM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	CMPD101, CMPD-101
靶点 (Target)	GRK2/3
通路 (Pathway)	Epigenetics--PKC
CAS 号 (CAS NO.)	865608-11-3
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₂₁ F ₃ N ₆ O
分子量 (Molecular Weight)	466.46
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°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C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. 粉末溶解前请先短暂离心, 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)

细胞实验 (体外实验)

在 HEK-B2 细胞, CMPD101 (100 μM)抑制β2AR 的内化, 显著减少异丙肾上腺素诱导的网格蛋白包被囊泡的形成, 并使β2AR-GFP 融合蛋白留在质膜上。^[1] 在大鼠蓝斑神经元中, CMPD101 (3-30 μM)预处理抑制了 Met-Enk 或 DAMGO 诱导的急性 MOPr 脱敏。在小鼠蓝斑神经元中, CMPD101 (3 或 30 μM)预处理抑制了 Met-Enk 诱导的急性 MOPr 脱敏。在外源表

达 HA-MOPrs 的 HEK 293 细胞中, CMPD101 (30 μ M)还阻止了 DAMGO 诱导的 MOPr 在 Thr 370、Thr 376 和 Thr 379 残基的磷酸化, 抑制蛋白募集和内化, 增加基础 ERK1/2 磷酸化, 不抑制 DAMGO 诱导的 Elk-1 磷酸化的增加。^[2]

参考文献

- [1]. Okawa T, et al. Design, Synthesis, and Evaluation of the Highly Selective and Potent G-Protein-Coupled Receptor Kinase 2 (GRK2) Inhibitor for the Potential Treatment of Heart Failure. *J Med Chem.* 2017 Aug 24;60(16):6942-6990.
- [2]. Lowe JD, et al. Role of G Protein-Coupled Receptor Kinases 2 and 3 in μ -Opioid Receptor Desensitization and Internalization. *Mol Pharmacol.* 2015 Aug;88(2):347-56.