

Catalog Number: CM06017

产品信息

Catalog Number:
CM06017

CAS号:
133053-19-7

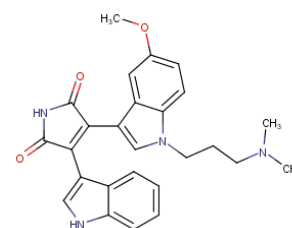
分子式:
C₂₆H₂₆N₄O₃

主要靶点:
PKC

主要通路:
表观遗传|细胞骨架

分子量:
442.51

溶解度:
DMSO:22.1 mg/mL (50 mM)



靶点活性

PKC β :7 nM|PKC ζ :60 nM|PKC α :7 nM|PKC δ :10 nM|PKC γ :6 nM

体外活性

22.0 μg i.v. Go6983强烈抑制小鼠肺B16BL6肿瘤模型中51.2%的肿瘤转移。

体内活性

Go 6983是靶向作用于ATP结合位点的亚型特异性PKC抑制剂。Go6983抑制ΔPfkB活性,IC₅₀为1 μM。1 μM Go6983与390 nM Ro-31-8425联用轻微抑制PGSMCs中Angiotensin II诱导的PLD2活性。在Go 6983 (5 μM) 处理的细胞中,下一个循环中的环数与对照培养物相比明显更少。Go 6983 (5 μM) 处理导致恶性疟原虫培养物中新环形成减少近60%。300 μM Go6983抑制转染PKC μ的NIH3T3细胞中PKC μ自磷酸化降低20%。心脏再灌注PMNs和100 nM Go6983,左心室发展压和左心室发展压率分别恢复到基准值的89%和74%,明显高于PMNs单独处理。与心脏缺血再灌注(I/R) + PMN相比,100 nM Go6983 PMNs对内皮细胞的粘附和心肌浸润,并显著抑制了PMNs超氧化物释放90%。Go6983在PMNs存在时,降低I/R后心肌收缩功能障碍,这可能与降低超氧化物的产生相关。Go6983明显抑制先前对树花粉致敏的患者的抗原诱导的超氧化物从白细胞释放。Go6983抑制人类血管组织细胞内的Ca(2+)累积,说明其血管舒张特性机制。

描述

Go 6983 is a pan-PKC inhibitor against for PKC α, PKC β, PKC γ, PKC δ and PKC ζ with IC₅₀ of 7 nM, 7 nM, 6 nM, 10 nM and 60 nM, respectively.

储存

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