

GSK2606414

产品信息

产品名称	产品编号	规格
GSK2606414	53748ES05	2 mg
	53748ES08	5 mg

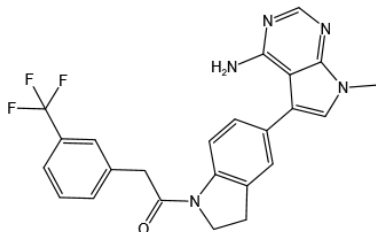
产品描述

GSK2606414 (GSK-2606414)是可口服的 PERK 选择性抑制剂，直接与 PERK 结合抑制其活性， IC_{50} 为 0.4 nM。蛋白激酶样内质网激酶 PERK 位于内质网中，具有丝氨酸/苏氨酸蛋白激酶活性，能够磷酸化失活 eIF2 α ，使蛋白质合成过程启动暂停，诱导细胞凋亡。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GSK2606414, GSK-2606414
靶点 (Target)	PERK
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage--PERK
CAS 号 (CAS NO.)	1337531-36-8
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₂₀ F ₃ N ₅ O
分子量 (Molecular Weight)	451.44
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）

（一）细胞实验（体外实验）

在 A549 细胞中，GSK2606414 (30 nM)完全抑制 PERK 的磷酸化。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

在胰腺癌异种移植瘤小鼠模型中，口服 GSK2606414 (50-150 mg/kg)剂量依赖性抑制肿瘤生长。GSK2606414 在小鼠、大鼠和狗的体内，口服有效性高，血液清除率低。^[1]

参考文献

- [1]. Axten JM, et al. Discovery of 7-methyl-5-(1-([3-(trifluoromethyl)phenyl]acetyl)-2,3-dihydro-1H-indol-5-yl)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-amine (GSK2606414), a potent and selective first-in-class inhibitor of protein kinase R (PKR)-like endoplasmic reticulum kinase (PERK). J Med Chem. 2012 Aug 23;55(16):7193-207.
- [2]. Zhang M, et al. Inhibiting the Plasmodium eIF2 α Kinase PK4 Prevents Artemisinin-Induced Latency. Cell Host Microbe. 2017 Dec 13;22(6):766-776.e4.