

## PKG drug G1

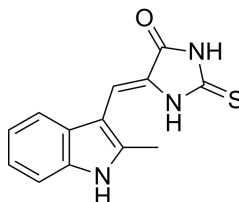
产品编号: MC11441

质量标准: >99%,BR

包装规格: 5mg / 10mg / 25mg / 50mg / 100mg

产品形式: 固体

### 基本信息:

分子式	C <sub>13</sub> H <sub>11</sub> N <sub>3</sub> OS	结构式	
分子量	257.31		
CAS No.	374703-78-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	湿冰运输		

简介: PKG drug G1 靶向作用于 PKG I $\alpha$ 。它通过 C42 PKGI $\alpha$ 非依赖性机制, 促进血管舒张以及血压降低。

别名: PKG drug G1

### 物理性状及指标:

外观: .....红棕色固体

溶解性: .....DMSO: 90mg/mL (超声助溶); 水: <5mg/mL

有机溶剂残留: .....符合 ICH 及中国药典规定

纯度: .....>99%

### 生物活性:

体外研究	<p>PKG drug G1 (10~50<math>\mu</math>M; 离体血管环; 大鼠主动脉平滑肌细胞)可有效舒张野生型小鼠二级肠系膜动脉、胸主动脉、颈动脉、肾动脉及股动脉 (小血管效应更强), 该作用依赖 PKG I<math>\alpha</math>的 C42 位点并可被 PKG 抑制剂 KT5823 减弱;</p> <p>PKG drug G1 单独处理不诱导 VASP Ser239 磷酸化, 但与 8-Br-cGMP (10<math>\mu</math>M)协同增强该磷酸化水平。</p>
体内研究	<p>PKG drug G1 (腹腔注射 3.7~14.8mg/kg 或口服 20mg/kg/天; 血管紧张素 II 诱导的高血压小鼠模型; 健康小鼠)在高血压野生型小鼠中剂量依赖性降低平均动脉压 (3.7mg/kg 下降 20.6<math>\pm</math>6.9 mmHg, 14.8mg/kg 下降 50.6<math>\pm</math>9.1mmHg), 口服 4 天降压持续, 但对 C42S PKG I<math>\alpha</math>基因敲入小鼠无效;</p> <p>PKG drug G1 在健康小鼠中, 7.4-14.8 mg/kg (i.p.)不改变血压但引起反射性心动过速 (心率显著增加); 此外, PKG drug G1 处理可在小鼠主动脉中诱导 PKG I<math>\alpha</math>蛋白间二硫键二聚体形成。</p>

### 溶液配制:

制备储备液	浓度 \ 溶剂体积 \ 质量	1mg	5mg	10mg
	1mM	3.8864mL	19.4318mL	38.8636mL
5mM	0.7773mL	3.8864mL	7.7727mL	
10mM	0.3886mL	1.9432mL	3.8864mL	



使用方法：（仅供参考）

<b>酶活试验</b>	建立基于荧光体的体外筛选方法，用于鉴定能诱导重组 PKG $\alpha$ 在 C42 位点发生氧化的化合物。先用 TCEP 还原重组 PKG $\alpha$ ，再与候选亲电性化合物孵育，随后加入二溴双甲酰（dBBr）。若化合物诱导 C42 残基形成二硫键（同源二聚体），则会阻止 dBBr 加成，导致荧光信号降低。从约 300 种化合物中筛选出 G1，可降低 dBBr 荧光信号 93.7%。
<b>细胞试验</b>	<p>Cell lines: 大鼠主动脉平滑肌细胞</p> <p>Concentrations: 10~50<math>\mu</math>M PKG drug G1, 10~50<math>\mu</math>M 8-Br-cGMP, 或两者组合</p> <p>Incubation Time: 10 分钟</p> <p>Method: 将细胞暴露于上述浓度的化合物中, 37<math>^{\circ}</math>C 处理 10 分钟; 裂解细胞后, 使用抗磷酸化 VASP (Ser239) 抗体通过蛋白质免疫印迹法检测 PKG 通路激活情况</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>诱导肺癌模型</b></p> <p>Animal Models: 雄性野生型 (WT) 和 PKG <math>\alpha</math> Cys42Ser 敲入 (KI) 小鼠</p> <p>Formulation: 腹腔注射时-DMSO 溶解再分散于生理盐水中; 口服-混悬于生理盐水中</p> <p>Dosages: 腹腔注射 3.7~14.8mg/kg; 口服 20mg/kg/天, 连续 4 天</p> <p>Administration: 腹腔注射或口服</p>

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理（如 0.22 $\mu$ m 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。
- 科研试剂，广泛应用于分子生物学、药理学等科研方面，严禁用于人体。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

S260501

