

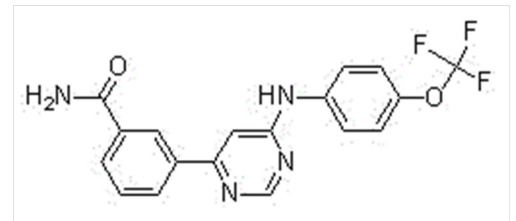
## GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1081-10mM	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1081-5mg	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1081-25mg	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	3-[6-[4-(trifluoromethoxy)anilino]pyrimidin-4-yl]benzamide
简称	GNF-2
别名	GNF 2, GNF2
中文名	N/A
化学式	C <sub>18</sub> H <sub>13</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>
分子量	374.32
CAS号	778270-11-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.34ml DMSO, 或每3.74mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1081-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	GNF-2是一种高选择性, 非ATP竞争性的Bcr-Abl抑制剂, 对Flt3-ITD、Tel-PDGFR、TPR-MET和Tel-JAK1转化的肿瘤细胞没有作用活性。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad				
靶点	Bcr-Abl (SUP-B15 cell line)	Bcr-Abl (K562 cell line)	—	—	—
IC50	268nM	273nM	—	—	—
体外研究	GNF-2抑制Bcr-abl阳性细胞生长, IC50值为273nM(K562)和268nM(SUP-B15), 这种作用具有剂量依赖性。GNF-2抑制Ba/F3.p210E255V Ba/F3.p185Y253H细胞生长, IC50分别为268nM和194nM。GNF-2(1μM)诱导Ba/F3.p210细胞和Ba/F3.p210E255V细胞发生细胞凋亡。GNF-2抑制Bcr-abl细胞酪氨酸磷酸化, IC50为267nM, 这种作用具有剂量依赖性。GNF-2(1μM)作用于Ba/F3.p210细胞, 显著降低phospho-Stat5水平。GNF-2结合到Bcr-abl的烷基结合袋中。GNF-2抑制非烷基化的c-Abl的激酶活性效果比抑制烷基化c-Abl好, 通过结合到激酶域的C端中段结构的烷基结合袋中。GNF-2(10μM)需要BCR和/或c-Abl SH3和/或SH2域, 用来抑制BCR-Abl依赖性的细胞增殖。GNF-2, 而非甲基化的GNF-2类似物, 使c-Abl结合到3T3成纤维细胞分离的细胞提取物中。GNF-2(10μM)显著抑制CrkII酪氨酸磷酸化, 这种作用存在剂量依赖性。GNF-2作用于表达c-AblG2A的细胞, 抑制CrkII磷酸化, IC50为0.051μM。GNF-2(10μM)与Imatinib(1μM)联用降低抗1μM Imatinib的细胞数, 降低至少90%。GNF-2作用于表达p210Bcr-Abl和p210Bcr-Ab突变的BafF3细胞, 抑制自磷酸化和细胞增殖。GNF-2(8nM)与GNF-5(20nM)联用, 增强对Abl64-515激酶活性的抑制效果。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	重组蛋白(100nM)或免疫沉淀的蛋白在激酶buffer(20mM HEPES(pH 7.4)、50mM KCl、0.1% CHAPS、30mM MgCl <sub>2</sub> 、2mM MnCl <sub>2</sub> 、1mM DTT和1%甘油)中稀释。稀释的蛋白等分与DMSO或化合物在室温下预温育30分钟, 然后加到K-LISA PTK EAY反应板中。加入0.1mM ATP开始激酶反应, 反应在室温下进行30分钟。通过SDS-PAGE和荧光成像分析或放射自显影检测GST-Abltide的磷酸化。

细胞实验	
细胞系	Ba/F3.p210、Ba/F3.p210E255V和Ba/F3.p185Y253H细胞
浓度	10 $\mu$ M
处理时间	48小时
方法	细胞(0.3–0.6 $\times$ 10 <sup>6</sup> /ml)按一式两份或一式三份接种在含浓度不断增高的GNF-2(5nM–10 $\mu$ M)的96孔板中。在37°C含5% CO <sub>2</sub> 的环境下温育48小时后，通过MTT比色法测定GNF-2对细胞活性的影响。测定IC <sub>50</sub> 值。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

- 1.Adrián FJ, et al. Nat Chem Biol. 2006, 2(2), 95-102
- 2.Choi Y, et al. J Biol Chem, 2009, 284(42), 29005-29014.
- 3.Zhang J, et al. Nature. 2010, 463(7280), 501-506.
- 4.Fabbro D, et al. Biochim Biophys Acta. 2010, 1804(3), 454-462.

➤ **包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1081-10mM	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC1081-5mg	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1081-25mg	GNF-2 (Bcr-Abl抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01