

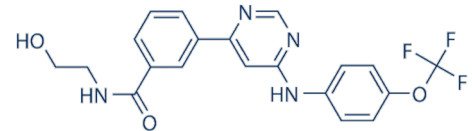
GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1126-10mM	GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1126-5mg	GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1126-25mg	GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-(2-hydroxyethyl)-3-[6-[4-(trifluoromethoxy)anilino]pyrimidin-4-yl]benzamide
简称	GNF-5
别名	GNF 5, GNF5
中文名	N/A
化学式	C ₂₀ H ₁₇ F ₃ N ₄ O ₃
分子量	418.37
CAS号	778277-15-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 83mg/ml; Ethanol 20mg/ml
溶液配制	5mg加入1.20ml DMSO, 或每4.18mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1126-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	GNF-5是一种选择性的, 变构的Bcr-Abl抑制剂, IC ₅₀ 为220nM。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad				
靶点	Bcr-Abl	—	—	—	—
IC ₅₀	220nM	—	—	—	—
体外研究	GNF-5, 与imatinib或nilotinib结合使用时, 抑制体外耐药变异的出现, 并在抗Bcr-Abl T315I突变体的生物化学和细胞试验中表现出额外的抑制活性。GNF-5表现出有效的抗增殖活性, 对wt-Bcr-Abl和E255K突变型Bcr-Abl细胞的EC ₅₀ 分别为430nM和580nM。				
体内研究	GNF-5(100毫克/千克)对异种移植和骨髓移植模型中野生型和T315I Bcr-Abl依赖性增殖显示出疗效。此外, GNF-5(75毫克/千克)与nilotinib(50毫克/千克)结合能够提高T315I Bcr-Abl BMT模型中总存活数。				
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	ATP/NADH-耦合测定系统以96孔格式用于确定Abl酪氨酸激酶催化的多肽磷酸化的初始速率。反应混合物包含20mM Tris-HCl, (pH 8.0), 50mM NaCl, 10mM MgCl ₂ , 2mM PEP[2-(磷酸氧基)-2-丙烯酸]和20微克Abl多肽底物(EAIYAAPFAKKK), 固定的或变化的(测定抑制剂动力学参数)抑制剂应用浓度, 1/50的PK/LDH酶(丙酮酸激酶/取自兔子肌肉的乳酸脱氢酶)的终反应体积, 160μM NADH, 0.16μM Abl, 最后加入ATP启动反应。吸光度数据在340nm下使用SpectraMax M5酶标仪每20分钟收集一次。

细胞实验	
细胞系	Ba/F3.p210细胞
浓度	~10μM
处理时间	48小时
方法	Ba/F3.p210细胞通过转染IL-3依赖的小鼠造血Ba/F3细胞系得到, 含有p210BCR-ABL和Bcr-Abl突变的pEYK载体。所有细胞系在含10%胎牛血清(FBS)的RPMI 1640中于5% CO ₂ , 37°C下进行培养, 并用1%左旋谷酰胺增补。亲代Ba/F3细胞也以类似方法培养, 10% WEHI条件培养基作为IL-3源。转染的细胞系在培养基中培养, 用25微克/毫升博来霉素增补。48小时的细胞增殖研究通过CellTiter-Glo试验获得。

动物实验	
动物模型	Ba/F3.p210异种移植小鼠模型
配制	PEG400/生理盐水, 1: 1
剂量	~100毫克/千克
给药方式	口服

➤ 参考文献:

- 1.Zhang J, et al. Nature. 2010, 463(7280), 501-506.
- 2.Deng X, et al. J Med Chem. 2010, 53(19), 6934-6946.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1126-10mM	GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1126-5mg	GNF-5 (Bcr-Abl抑制剂)	5mg
SC1126-25mg	GNF-5 (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:

- 本产品对人体有毒, 操作时请特别小心, 并注意有效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