

GNF-7

产品编号: D50369

CAS: 839706-07-9

保存条件: Store at -20°C for 3 year(Powder); In DMSO or others solvent store at 2-4°C for two weeks, at -20°C for six months.

产品介绍: **基本信息:**

CAS: 839706-07-9

分子式: C₂₈H₂₄F₃N₇O₂

分子量: 547.53

纯度: 99%

外观: 白色粉末

溶解性: 溶于DMSO (20mg/ml)

配制方法: 10 mM (5mg/0.91ml DMSO)

产品简介:

GNF-7是一种多重激酶抑制剂。GNF-7是Bcr-Abl的抑制剂, 对Bcr-Abl (WT) 和Bcr-Abl (T315I) 作用的IC₅₀值分别为133nM和61nM。GNF-7对ACK1和GCK也具有抑制活性, IC₅₀分别为25nM和8nM。GNF-7可用于血液恶性肿瘤的研究。

作用靶点: BCR-ABL1;

作用通路: Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling; TGF-beta/Smad;

体外研究:

GNF-7对表达有野生型和突变型Bcr-Abl的Ba/F3细胞中表现了高效的抗增殖活性, 其IC₅₀值均小于11nM。在人源结肠癌细胞系Colo205和SW620中, GNF-7也表现了出色的生长抑制活性, 其IC₅₀分别为5 nM和1 nM。GNF-7通过对ACK1/AKT和GCK的联合抑制, 高效并且选择性的抑制了NRAS依赖性的AML和ALL细胞的生长。

体内研究:

GNF-7在小鼠中表现了很好的药代动力学特性。在一个移植有T315I-Bcr-Abl-Ba/F3肿瘤的荧光小鼠模型中, GNF-7 (10 mg/kg, p.o.)有效地抑制了肿瘤的生长。在移植有人源的表达突变型NRAS的MOLT-3-luc+细胞的NSG小鼠中, GNF-7 (15 mg/kg, p.o.)显著的下降了疾病的表现, 延长了总体的寿命并且强烈地抑制了phospho-AKT和phospho-RPS6的水平。