www.bioss.com.cn
sales@bioss.com.cn
techsupport@bioss.com.cn
400-901-9800

GNF 2

产品编号： D50373

CAS: 778270-11-4

产品介绍： **基本信息：**

CAS：778270-11-4

分子式：C18H13F3N4O2

分子量：374.32

MDL：MFCD09265253

纯度：≥98%

溶解性：溶于DMSO，乙醇

作用靶点：BCR-ABL1;

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

用途/描述：GNF-2是一种高选择性，非ATP竞争性的Bcr-Abl抑制剂，GNF-2 抑制 Ba/F3.p210 增殖， IC50 为 138 nM。对Flt3-ITD， Tel-PDGFR， TPR-MET和Tel-JAK1转化的肿瘤细胞没有作用活性。

体外研究：

GNF-2抑制Bcr-abl阳性细胞生长，IC50值为273 nM (K562) 和 268 nM (SUP-B15)，这种作用具有剂量依赖性。GNF-2抑制Ba/F3.p210^{E255V} Ba/F3.p185^{Y253H}细胞生长，IC50分别为268 nM 和 194 nM。GNF-2 (1 μM)诱导 Ba/F3.p210 细胞和 Ba/F3.p210^{E255V} 细胞发生细胞凋亡。GNF-2抑制Bcr-abl细胞酪氨酸磷酸化，IC50 为267 nM，这种作用具有剂量依赖性。GNF-2 (1 μM) 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端半段结构的烷基结合袋中。GNF-2 (10 μM) 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 (10 μM)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 0.051 μM。GNF-2 (10 μM) 与Imatinib (1 μM) 联用降低抗1 μM 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 (8 nM)与GNF-5 (20 nM) 联用，增强对Abl64–515激酶活性的抑制效果。

Important Note: This product as supplied is intended for research use only, not for use in human, therapeutic or diagnostic applications.