

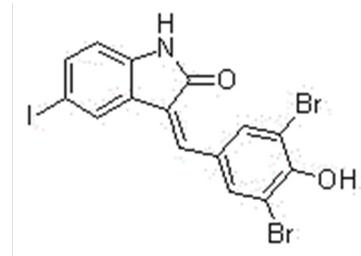
GW5074 (Raf抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD5955-10mM	GW5074 (Raf抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5955-5mg	GW5074 (Raf抑制剂)	5mg
SD5955-25mg	GW5074 (Raf抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(3Z)-3-[(3,5-dibromo-4-hydroxyphenyl)methylidene]-5-iodo-1H-indol-2-one
简称	GW5074
别名	GW 5074, GW-5074
中文名	N/A
化学式	C ₁₅ H ₈ Br ₂ INO ₂
分子量	520.94
CAS号	220904-83-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 104mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.96ml DMSO, 或每5.21mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD5955-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	GW5074是一种有效的, 选择性的c-Raf抑制剂, IC ₅₀ 为9nM, 对JNK1/2/3、MEK1、MKK6/7、CDK1/2、c-Src、p38 MAP、VEGFR2和c-Fms没有抑制活性。				
信号通路	MAPK				
靶点	C-Raf	—	—	—	—
IC ₅₀	9nM	—	—	—	—
体外研究	GW5074是有效的, 特异性c-Raf抑制剂, IC ₅₀ 为9nM, 在体外对MEK6、MKK7、p38 MAP激酶和cdks没有抑制活性。然而GW5074处理神经元培养基, 使c-Raf和B-Raf的激活修饰累积。GW5074处理小脑颗粒神经元, 抑制LK诱导的凋亡, 这种作用是非MEK-ERK依赖性的。GW5074延迟下调Akt活性, 但通过Akt非依赖性机制抑制细胞凋亡。GW5074影响Ras、NF-kappa B和c-jun。GW5074作用于颗粒细胞和其他神经元类型, 抑制神经毒素引起的细胞死亡。				
体内研究	GW5074保护Huntington病的体内实验模型。GW5074(5mg/Kg)处理小鼠, 完全抑制3-NP诱导的双侧纹状体病变。GW5074作用于稳定表达人类阿片受体的CHO细胞, 完全废除慢性吗啡介导的AC超活化I。GW5074处理小鼠, 抑制侧流烟雾引起的气道高反应性。				
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	通常使用纯化的激酶和合成的底物在标准条件下进行体外激酶实验。每组实验使用5-10mU纯化的激酶。GSK3β、cdk1、cdk2、cdk3、cdk5实验中, 激酶与1μM GW5074在含8mM MOPS, pH 7.2, 0.2mM EDTA, 10mM醋酸镁和[c-33P-ATP]的Buffer中在室温下温育40分钟。等样加到P30过滤器上, 测量33P渗透率而定量分析激酶活性, 然后在50mM磷酸中洗涤, 进行闪烁计数。Buffer组成包含c-Raf、JNK1、JNK2、JNK3、MEK1、MKK6、MKK7、50mM Tris pH 7.5、0.1mM EGTA、10mM醋酸镁和[c-33P-ATP]。使用的肽底物如下: c-Raf使用0.66mg/ml MBP; cdks使用0.1mg/ml组蛋白H1; JNKs使用3μM ATF2; MEK1使用1μM MAPK2; MKK6使用 1μM SAPK2a, MKK7使用2μM JNK1α。

细胞实验	
细胞系	皮层神经元

浓度	~5 μ M
处理时间	24小时
方法	HCA稀释100倍，调节到pH 7.5。为了测评GW5074对HCA诱导的细胞毒性的影响，GW5074添加到HCA处理的皮层神经元中。24小时后，测定活力。

动物实验	
动物模型	处理50-55mg/kg 3-NP的8周大的C57BL/6雄性小鼠
配制	溶于生理盐水
剂量	0.5-10mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Chin PC, et al. J Neurochem, 2004, 90(3), 595-608.
- 2.Yue X, et al. Eur J Pharmacol, 2006, 540(1-3), 57-59.
- 3.Lei Y, et al. Respir Res, 2008, 9(1), 71.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD5955-10mM	GW5074 (Raf抑制剂)	10mM×0.2ml
SD5955-5mg	GW5074 (Raf抑制剂)	5mg
SD5955-25mg	GW5074 (Raf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