

GW2580

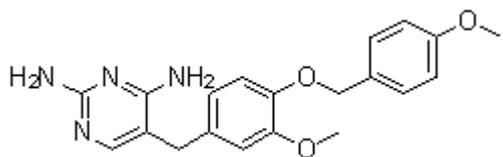
产品编号：MB3918

质量标准：>98%，选择性 CSF-1R 抑制剂

包装规格：10MG;25MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₂₂ N ₄ O ₃	结构式	
分子量	366.41		
CAS No.	870483-87-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 48 mg/mL (131.0 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：GW2580 是选择性 CSF-1R 抑制剂，作用于 c-FMS。

别名：2,4-Pyrimidinediamine, 5-[[3-methoxy-4-[(4-methoxyphenyl)methoxy]phenyl]methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 48 mg/mL (131.0 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7292 mL	13.6459 mL	27.2918 mL
5 mM	0.5458 mL	2.7292 mL	5.4584 mL
10 mM	0.2729 mL	1.3646 mL	2.7292 mL

50 mM	0.0546 mL	0.2729 mL	0.5458 mL
-------	-----------	-----------	-----------

生物活性

产品描述	GW2580 是选择性 CSF-1R 抑制剂，作用于 c-FMS 时，IC50 为 30 nM,比作用于 b-Raf, CDK4, c-KIT, c-SRC, EGFR, ERBB2/4, ERK2, FLT-3, GSK3, ITK, JAK2 等的选择性高 150 到 500 倍。
靶点	c-FMS
IC50	30 nM
体外研究	0.06 μ M GW2580 在体外完全抑制人类 CFMS 激酶。GW2580 抑制 CSF-1 刺激的 M-NFS-60 骨髓瘤细胞，血清刺激的 NSO 骨髓瘤细胞，CSF-1 刺激的新鲜分离的人单核细胞，和 VEGF 刺激的人脐静脉血管内皮细胞的生长，IC50 分别为 0.33, 13.5, 0.47 和 12 μ M。1 μ M GW2580 作用于人类破骨细胞，大鼠颅骨，和大鼠胎儿长骨的培养基，完全抑制 CSF-1 诱导的小鼠 M-NFS-60 骨髓细胞和人单核细胞的生长，且完全抑制骨退化。GW2580 作用于 RAW264.7 小鼠巨噬细胞，抑制 CSF1R 磷酸化，IC50 约为 10 nM。GW2580 也抑制 TRKA 活性，IC50 为 0.88 μ M。
体内研究	GW2580 (按 40 mg/kg 剂量口服处理小鼠 0.5 小时)，抑制外源性 CSF-1 促进 LPS 诱导的 TNF- α 生成的能力，抑制达 63%。GW2580 处理小鼠，然后再使用 CSF-1 处理，完全抑制 CSF-1 提高小鼠 IL-6 产量的能力。GW2580(80 mg/kg 口服处理)完全抑制腹腔内 CSF-1 依赖性的 M-NFS-60 肿瘤细胞的生长。GW2580(80 mg/kg)口服处理，每天两次，持续一周，然后注射巯基乙酸 4 天，降低了 45% 巨噬细胞的积。GW2580(50 mg/kg)处理佐剂性关节炎模型，为期 21 天，每天处理 2 次，按 0 到 21 天，7 到 21 天，或 14 到 21 天的日程处理，抑制关节结缔组织和骨破坏。GW2580(160 mg/kg)处理移植的 3LL 肺肿瘤，诱导全部的 CD45+ CD11b+ 骨髓细胞，CD11b+ F4/80+TAMs, 和 CD11b+ Gr-1+ MDSCs 减少 2 倍以上。GW2580(80 mg/kg)处理，Vegf-a (抑制 35%) 和 Mmp9 (抑制 70%)表达，以及肿瘤的血管密度 (CD31 染色)。GW2580 与 anti-VEGFR-2 抗体联合疗法，协同降低肿瘤生长。DC101 单独处理，仅降低了 35% 肿瘤生长，DC101 和 GW2580 联用处理，显著协同降低肿瘤生长，降低约 70%。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3993	OSI-930
--------	---------

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。GW2580 是选择性 CSF-1R 抑制剂，作用于 c-FMS。本品可用于相关领域的科研实验。

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	cFMS 酪氨酸激酶实验: 10 μ M 酶, 100 μ M ATP,和 5 mM MgCl ₂ 在 50 mM Tris HCL 中在室温下温育 90 分钟，通
-------------	-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------

	<p>过自磷酸化而使酶激活。使用圆底聚苯乙烯 96 孔板，在 Biomek 2000 上进行酶反应，反应体积为 45 μL。每孔加入溶于 1 μL DMSO 的化合物或只加入 DMSO，孔中有含 50 mM Mops(3-[N-Morpholino] 丙磺酸)的 30 μL 1.5\times底物反应混合物，pH 7.5, 15 mM MgCl₂, 6 μM 肽底物, 生物素-EAIYAPFAKKK-NH₂ 7.5 mM DTT, 75 mM NaCl, 10 μM ATP, 和 0.5 μCi(1 Ci = 37 GBq)[³³P-γ] ATP。加入 15 μL 稀释的酶溶液开始反应，最终酶浓度为 20 nM。EDTA 加入到对照孔中。反应进行 40 分钟，加入等体积的 0.5%磷酸终止反应，75 μL 转移到已用 100μL 0.5%的磷酸预湿的 96 孔磷酸纤维素过滤板上。实验板在 Millipore 过滤板真空歧管上过滤，然后使用磷酸溶液洗涤三次，随后加入 40 μL 闪烁液。实验板进行密封，然后使用 Packard Topcount NXT 闪烁计数器进行计数。</p>
<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: MCSF 依赖性小鼠骨髓 M-NFS-60 细胞系 Concentrations: ~20 μM Incubation Time: 3 天 Method: 细胞自旋减慢后，按 2×10^6 细胞/mL 置于培养基中饥饿处理 24 小时，一天后开始细胞生长实验。进行 M-NSF60 细胞生长实验的培养基缺乏 MCSF。实验第二天，溶于 DMSO 的 10 mM GW2580 稀释至 20μM，与 0.2%DMSO 在含 10%血清的培养基中，连续稀释，获得一个 10 点浓度曲线。M-NFS-60 细胞按 0.5×10^6 细胞/mL 再悬浮于含 10%血清和 20 ng/mL 小鼠 MCSF 的培养基中。细胞(50 μL)加到含抑制剂(50 μL)的孔中，3 天后，每孔加入,10 μL WST-1 试剂。温育 4 小时后，在 440 nm 处测定吸光度，计算含全培养基和饥饿培养基的孔中的细胞生长差异。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 携带骨髓瘤移植瘤 M-NFS-60 的小鼠 Formulation: 0.5%羟丙基甲基纤维素和 0.1% Tween 80 Dosages: 80 mg/kg Administration: 口服处理，每天两次</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。