

GW5074

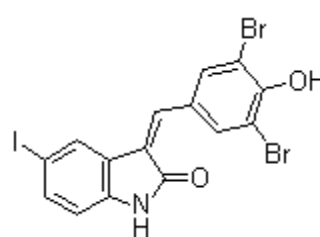
产品编号: MB4071

质量标准: >98%, c-Raf 抑制剂

包装规格: 5MG;25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C15H8Br2INO2	结 构 式	
分子量	520.94		
CAS No.	220904-83-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 104 mg/mL (199.63 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: GW 5074 是一种有效的, 选择性的 c-Raf 抑制剂, 对 JNK1/2/3, MEK1, MKK6/7, CDK1/2, c-Src, p38 MAP, VEGFR2 或 c-Fms 等没有作用。

别名: 2H-Indol-2-one, 3-[(3,5-dibromo-4-hydroxyphenyl)methylene]-1,3-dihydro-5-iodo

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 104 mg/mL (199.63 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	GW5074 是有效的, 选择性 c-Raf 抑制剂, IC ₅₀ 为 9 nM,对 JNK1/2/3, MEK1, MKK6/7, CDK1/2, c-Src, p38 MAP, VEGFR2 和 c-Fms 没有抑制活性。
靶点	c-Raf
IC ₅₀	9 nM
体外研究	GW5074 是有效的, 特异性 c-Raf 抑制剂, IC ₅₀ 为 9 nM,在体外对 MEK6, MKK7, p38 MAP 激酶和 cdk5 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(5 mg/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。
--	--

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)

MB4072	ZM 336372
MB3922	CEP-32496
MB4070	SB590885

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。GW5074 是有效的，选择性 c-Raf 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9196 mL	9.5980 mL	19.1961 mL
5 mM	0.3839 mL	1.9196 mL	3.8392 mL
10 mM	0.1920 mL	0.9598 mL	1.9196 mL
50 mM	0.0384 mL	0.1920 mL	0.3839 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	亲和力测定: 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 5-10 mU 纯化的激酶。GSK3β, cdk1, cdk2, cdk3, cdk5 实验中,激酶与 1 μM GW5074 在含 8 mM MOPS, pH 7.2, 0.2 mM EDTA, 10 mM 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 50 mM 磷酸中洗涤, 进行闪烁计数。Buffer 组成包含 c-Raf, JNK1, JNK2, JNK3, MEK1, MKK6, MKK7, 50 mM Tris pH 7.5, 0.1 mM EGTA, 10 mM 醋酸镁和[c-³³P-ATP]。使用的肽底物如下: c-Raf 使用 0.66 mg/mL MBP;cdks 使用 0.1 mg/mL 组蛋白 H1;JNKs 使用 3 μM ATF2; MEK1 使用 1 μM MAPK2; MKK6 使用 1 μM SAPK2a, MKK7 使用 2 μM JNK1α。
细胞实验	Cell lines: 皮层神经元 Concentrations: ~5 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 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	Animal Models: 处理 50–55 mg/kg 3-NP 的 8 周大的 C57BL/6 雄性小鼠 Formulation: 溶于生理盐水 Dosages: 0.5–10 mg/kg Administration: 腹腔注射

【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。

活化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。如需制备储备液，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。