

GDC-0879

产品信息

产品名称	产品编号	规格
GDC-0879	53816ES08	5 mg
	53816ES25	25 mg

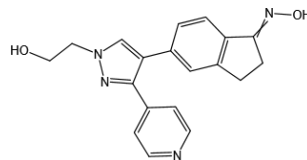
产品描述

GDC-0879 (GDC0879, AR-00341677, AR00341677)是可口服的 B-Raf 选择性抑制剂, IC₅₀ 为 0.13 nM, 抑制 B-Raf V600E 突变细胞系中的 Raf/MEK/ERK 信号通路, 具有潜在抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GDC-0879, GDC0879, AR-00341677, AR00341677
靶点 (Target)	BRAF V600E
通路 (Pathway)	MAPK/ERK--Raf
CAS 号 (CAS NO.)	905281-76-7
分子式 (Formula)	C ₁₉ H ₁₈ N ₄ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	334.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

在 A375 和 Colo205 细胞系中, GDC-0879 抑制 MEK1 磷酸化, IC₅₀ 分别为 59 和 29 nM。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

在小鼠中, 给药 GDC-0879 后细胞系和患者来源的 BRAF V600E 肿瘤均表现出更强和更持久的药效学抑制作用 (> 90%, 持续 8 小时), 并且与表达突变的 KRAS 肿瘤相比, 存活率有所提高。^[2]

参考文献

[1] Wong H, et al. Pharmacodynamics of 2-[4-[(1E)-1-(hydroxyimino)-2,3-dihydro-1H-inden-5-yl]-3-(pyridine-4-yl)-1H-pyrazol-1-yl]ethan-1-ol (GDC-0879), a potent and selective B-Raf kinase inhibitor: understanding relationships between systemic concentrations.

[2] Hoeflich KP, et al. Antitumor efficacy of the novel RAF inhibitor GDC-0879 is predicted by BRAFV600E mutational status and sustained extracellular signal-regulated kinase/mitogen-activated protein kinase pathway suppression. *Cancer Res.* 2009 Apr 1;69(7):3042-51.