

## GNF4877

## 产品信息

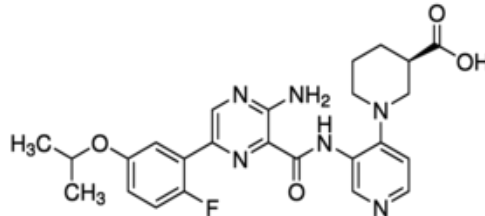
产品名称	产品编号	规格
GNF4877	52978ES03	1 mg
	52978ES08	5 mg

## 产品描述

GNF4877 (GNF-4877, GNF 4877)是一种有效的 DYRK1A 和 GSK3 $\beta$  抑制剂 (IC<sub>50</sub> 分别为 6 nM 和 16 nM)。GNF4877 可阻碍活化 T 细胞核输出的核因子过程, 并抑制  $\beta$  细胞增殖。

## 产品性质

英文别名 (English Synonym)	GNF-4877; GNF 4877
靶点 (Target)	GSK3 $\beta$ ; DYRK1A
CAS 号 (CAS NO.)	2041073-22-5
分子式 (Formula)	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>
分子量 (Molecular Weight)	494.52
外观 (Appearance)	固体粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	可溶于 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 2 年。建议分装后-20°C避光保存, 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)

为了检测 GNF4877 对人  $\beta$ -cell 细胞的影响, 通过去除强力霉素 2 天, 使人永生  $\beta$ -cell 细胞 R7T1 停止增殖, 并接种

$3 \times 10^3$  个数量的至 384 孔培养板中，添加不同浓度 (0.1, 1, 10, 100  $\mu\text{M}$ ) GNF4877 工作液，并培养孵育 5 天。经 Cell Titer-Glo assay 实验验证，GNF4877 以剂量依赖性的方式有效刺激细胞增殖。<sup>[1]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

为了检测 GNF4877 在体内促进  $\beta$ -cell 细胞增殖的作用，抑制少量人胰岛到免疫功能缺陷的基因敲除小鼠，并给予连续 9 天，每天两次 50 mg/kg 小鼠的 GNF4877，与未给予 GNF4877 对照组相比，实验组血糖控制能力增强。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Liu YA, Jin Q, et al. A Dual Inhibitor of DYRK1A and GSK3 $\beta$  for  $\beta$ -Cell Proliferation: Aminopyrazine Derivative GNF4877. ChemMedChem. 2020 Aug 19;15(16):1562-1570.
- [2]. Shen W, Taylor B, et al. Inhibition of DYRK1A and GSK3B induces human  $\beta$ -cell proliferation. Nat Commun. 2015 Oct 26; 6:8372.