

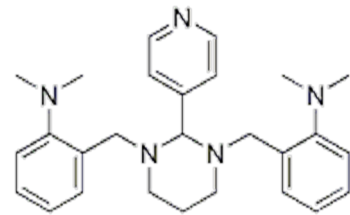
## GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF6818-10mM	GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)	10mM×0.2ml
SF6818-5mg	GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)	5mg
SF6818-25mg	GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[[3-[[2-(dimethylamino)phenyl]methyl]-2-pyridin-4-yl]-1,3-diazinan-1-yl]methyl]-N,N-dimethylaniline
简称	GANT61
别名	GANT 61, GANT-61, NSC136476, ChEMBL471728
中文名	N/A
化学式	C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub>
分子量	429.6
CAS号	500579-04-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 5mg/ml; Ethanol 12mg/ml
溶液配制	5mg加入1.16ml DMSO, 或每4.30mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF6818-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	GANT61是一种GLI1及GLI2诱导的转录抑制剂, 抑制hedgehog, 在表达GLI1的HEK293T细胞中IC50为5μM, 选择性作用于其他通路, 如TNF和糖皮质激素受体基因的转录。				
信号通路	Stem Cells & Wnt; GPCR & G Protein				
靶点	GLI1	—	—	—	—
IC50	5μM	—	—	—	—
体外研究	GANT61抑制GLI1及GLI2诱导的转录。GANT61抑制GLI1的DNA结合能力。GANT61抑制hedgehog信号, IC50为5μM, 比作用于其他通路选择性高, 如TNF信号/NFκB激活, 糖皮质激素受体基因转录, 及Ras-Raf-Mek-Mapk级联。GANT61在体外有效抑制肿瘤细胞增殖, 这种作用存在GLI依赖性。GANT61作用于慢性淋巴细胞性白血病细胞(CLL), 而非正常的B淋巴细胞, 诱导细胞凋亡。GANT61作用于人结肠癌细胞系, 具有强大的细胞毒性, 且废除集落生成。GANT61作用于人结肠癌细胞系的早S期阶段, 抑制DNA复制, 产生涉及ATM-Chk2信号轴的DNA损伤信号, 且诱导细胞死亡。GANT61(30μM)作用于急性髓系白血病(Aml)细胞, 导致生长停滞和凋亡。				
体内研究	GANT61处理注射GLI1-阳性22Rv1前列腺癌细胞的裸鼠, 诱导肿瘤生长衰退, 直到观察不到明显的肿瘤。GANT61按50mg/kg剂量口服饲喂处理携带SK-N-AS神经母细胞瘤移植瘤的裸鼠, 在实验第12天显著抑制肿瘤生长, 与对照组相比, 肿瘤体积减少63%。				
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	转染GLI1表达质粒的HEK 293细胞与报告质粒12×GliBSLuc和R-Luc一起置于10cm板上(实验第0天)。24小时后, 细胞接种按每孔15000个细胞的密度接种在白色透明底的96孔板中。细胞粘附, 加入溶于DMSO(DMSO终浓度为0.5%)的终浓度为10μM的化合物加(实验第1.5天)。细胞再生长24小时, 随后裂解, 然后使用双荧光素酶试剂盒进行分析。

细胞实验	
细胞系	PANC1或22Rv1
浓度	~5μM

处理时间	48小时
方法	进行BrdU渗透实验。在有5 $\mu$ M实验化合物(或DMSO)存在下，亚融合的细胞在含FBS(2.5%)的白色透明底的96孔板上生长48小时。随后，使用BrdU对细胞进行标记2小时，混合，然后分析。

动物实验	
动物模型	携带22Rv1细胞移植瘤的BALB/c裸鼠
配制	玉米油：乙醇，4：1
剂量	50mg/kg
给药方式	皮下注射

➤ **参考文献：**

- 1.Lauth M, et al. Proc Natl Acad Sci, 2007, 104(20), 8455-8560
- 2.Desch P, et al. Oncogene, 2010, 29(35), 4885-4895.
- 3.Mazumdar Y, et al. Cancer Res, 2011, 71(3), 1092-1102.
- 4.Mazumdar T, et al. Cancer Res, 2011,71(17), 5904-5914.
- 5.Pan D, et al. Leuk Res, 2012, 36(6), 742-748.
- 6.Wickstorm M, et al. Int J Cancer, 2013, 132(7), 1516-1524.

➤ **包装清单：**

产品编号	产品名称	包装
SF6818-10mM	GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)	10mM×0.2ml
SF6818-5mg	GANT61 (Hedgehog/Smoothened抑制剂)	5mg
SF6818-25mg	GANT61 (Hedgehog/Smoothened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