

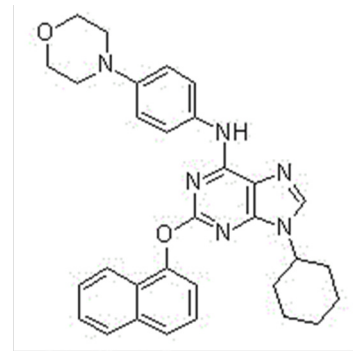
## Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SF6822-10mM	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	10mM×0.2ml
SF6822-5mg	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	5mg
SF6822-25mg	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	9-cyclohexyl-N-(4-morpholin-4-ylphenyl)-2-naphthalen-1-ylloxypurin-6-amine
简称	Purmorphamine
别名	UNII-PB12M2F8KY, Shh Signaling Antagonist VI, PB12M2F8KY
中文名	N/A
化学式	C <sub>31</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub>
分子量	520.62
CAS号	483367-10-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 4mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.96ml DMSO, 或每5.21mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF6822-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Purmorphamine直接结合并激活Smoothened, 阻断BODIPY-cyclopamine与Smo结合, 在HEK293T细胞中IC50约为1.5μM, 也诱导成骨细胞分化, EC50为1μM。				
信号通路	Stem Cells & Wnt; GPCR & G Protein				
靶点	Smoothened	—	—	—	—
IC50	~1.5μM	—	—	—	—
体外研究	Purmorphamine与Cyclopamine(一种Smo拮抗剂)竞争, 直接结合和激活Smoothened, 而激活Hedgehog通路, IC50为1.5μM。Purmorphamine作用于全能C3H10T1/2细胞, 是有效的骨生成诱导剂。Purmorphamine作用于C3H10T1/2细胞的EC50(根据ALP表达)为1μM。Purmorphamine (1μM)和BMP-4(100ng/ml)联用, 作用于3T3-L1细胞, 使ALP活性增强90多倍。与BMP-4相比, Purmorphamine作用于多能间充质祖细胞, 诱导骨生成, 通过激活Hedgehog信号。				
体内研究	Purmorphamine作用于基于大鼠结构的人间充质干细胞, 上调ALP表达。				
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	使用BODIPY-Cyclopamine和过表达Smo的细胞进行Smo结合实验, 使用CMV启动子, 含SV40起点的表达载体, 获得Smo-Myc3, 缺失突变体Smo CRD (68到182位氨基酸缺失)和Smo CT (556到793位氨基酸缺失)。HEK 293T细胞在12孔板中的聚-D-赖氨酸处理的玻璃盖玻片上生长, 直到70%汇合, 然后使用FuGene 6, 通过适当的表达载体(每孔0.5g)进行转染。转染两天后, HEK 293T细胞与含0.5%小牛血清, 5nM BODIPY-Cyclopamine和不同浓度的Purmorphamine(0、1.5或5M)(每孔1ml)的DMEM培养基在37°C下温育1小时。然后使用1×PBS缓冲液(每孔1ml)洗涤过表达Smo的细胞, 置于含DAPI的培养基, 使用Leica DM4500B荧光显微镜观察。使用固定细胞进行结合检测, 使用溶于1×PBS缓冲液(每孔1ml)的3%多聚甲醛在室温下固定过表达Smo的HEK293T细胞10分钟, 然后使用含10mM甘氨酸和0.2%叠氮化钠的1×PBS缓冲液(每孔1ml)处理5分钟, 使用1X PBS缓冲液(每孔1ml)洗涤, 然后再使用含Purmorphamine的培养基在室温下处理4小时。

细胞实验	
细胞系	C3H10T1/2细胞
浓度	0.5-10 $\mu$ M
处理时间	4天
方法	C3H10T1/2细胞在T175烧瓶中扩增，第13通道的细胞通过胰蛋白酶/EDTA分离，然后在生长培养基中稀释。使用Multi-drop <sup>TM</sup> 液体传输系统，将产生的细胞悬浮液按每孔2500个细胞接种到黑色透明底384孔板中，孔中为100 $\mu$ l生长培养基。温育过夜后，细胞附着到孔的底部。使用Mini Trak <sup>TM</sup> 多位分配系统，将溶于DMSO(500nl)的每组Purmorphamine储存液输送到对应孔中，确保Purmorphamine终浓度为5 $\mu$ M。然后细胞置于37 $^{\circ}$ C下含5% CO <sub>2</sub> 的空气中温育。4天后，除去培养基，10 $\mu$ l被动裂解缓冲液加入到每孔中。5分钟后，10 $\mu$ l碱性磷酸酶底物溶液添加到每孔中。在室温下温育15分钟后，在Acquest高通量酶标仪上对实验板进行读数。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

- 1.Sinha S, et al. Nat Chem Biol, 2006, 2(1), 29-30.
2. Wu X, et al. J Am Chem Soc, 2002, 124(49), 14520-14521.
3. Wu X, et al. Chem Biol, 2004, 11(9), 1229-1238.
- 4.Faghihi F, Biomed Pharmacother, 2012, 3322(12).

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF6822-10mM	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SF6822-5mg	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	5mg
SF6822-25mg	Purmorphamine (Hedgehog/Smoothened激动剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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的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