

## GANT-61 ; GANT61

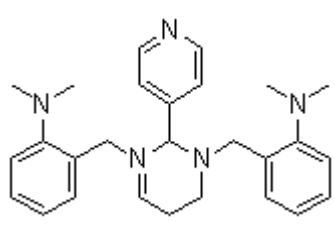
产品编号 : MB3701

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : 粉状

### 基本信息

分子式	C27H35N5	结 构 式	
分子量	429.6		
CAS No.	500579-04-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 12 mg/mL (27.93 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 :** GANT 61 是靶向 Hedgehog/GLI 通路的 Gli1 和 Gli2 抑制剂。

**别名 :** 2,2'-[[Dihydro-2-(4-pyridinyl)-1,3(2H,4H)-pyrimidinediyl]bis(methylene)]bis[N,N-dimethyl-benzenamine, NSC 136476

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色粉末

溶解性 : .....DMSO 12 mg/mL (27.93 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

<b>产品描述</b>	GANT61 抑制 GLI1 及 GLI2 诱导的转录, 抑制 hedgehog, IC50 为 5 μM, 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。
<b>靶点</b>	GLI1(HEK293T cells expressing GLI1)
<b>IC50</b>	5 μM
<b>体外研究</b>	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 5 $\mu$ M, 比作用于其他通路选择性高, 如 TNF 信号/NF $\kappa$ B 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 (30 $\mu$ M) 作用于急性髓系白血病 (AML) 细胞, 导致生长停滞和凋亡。
<b>体内研究</b>	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 50 mg/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%。

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)

MB4141	MK-4101
MB6516	Cyclopamine
MB5146	维莫德吉(GDC0449)

**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。GANT 61 是靶向 Hedgehog/GLI 通路的 Gli1 和 Gli2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3277 mL	11.6387 mL	23.2775 mL
5 mM	0.4655 mL	2.3277 mL	4.6555 mL
10 mM	0.2328 mL	1.1639 mL	2.3277 mL
50 mM	-	-	-

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验:</b>	<b>双荧光素酶含量:</b> 转染 GLI1 表达质粒的 HEK293 细胞与报告质粒 12 $\times$ GliBSLuc 和 R-Luc 一起置于 10 cm 板上 (实验第 0 天)。24 小时后, 细胞接种按每孔 15,000 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 10 $\mu$ M 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。
<b>细胞实验：</b>	<p><b>Cell lines:</b> PANC1 或 22Rv1</p> <p><b>Concentrations:</b> ~5 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 进行 BrdU 渗透实验。在有 5 <math>\mu</math>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。</p>
<b>动物实验：</b>	<p><b>Animal Models:</b> 携带 22Rv1 细胞移植瘤的 BALB/c 裸鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 玉米油：乙醇，4:1</p> <p><b>Dosages:</b> 50 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 皮下注射</p>

**【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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。

**活性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。如需制备储存液，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，否则会严重影响化合物活性，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。