

Catalog Number: CM04230

产品信息

Catalog Number:
CM04230

CAS号:
500579-04-4

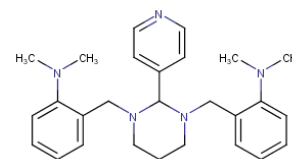
分子式:
C₂₇H₃₅N₅

主要靶点:
Autophagy|Hedgehog/Smoothed

主要通路:
自噬|G蛋白偶联受体|干细胞

分子量:
429.6

溶解度:
Ethanol:43 mg/mL (100
mM),DMSO:21.5 mg/mL (50 mM)



靶点活性

Gli1:5 μ M

体外活性

携带SK-N-AS神经母细胞瘤移植瘤的裸鼠口服喂50 mg/kg GANT61,在实验第12天明显抑制肿瘤生长,与对照组相比,肿瘤体积减少63%.在注射Gli1阳性22Rv1前列腺癌细胞的裸鼠中,GANT61诱导肿瘤生长退化,直到观察不到明显的肿瘤。

体内活性

GANT61以Gli依赖性方式有效抑制体外肿瘤细胞增殖。30 μ M GANT61导致急性髓系白血病细胞生长停滞和凋亡。GANT61对人结肠癌细胞系具有强大的细胞毒性,且消除集落生成。GANT61作用于慢性淋巴细胞性白血病细胞,而非正常的B淋巴细胞,诱导细胞凋亡。GANT61在人结肠癌细胞系的早期S期中诱导DNA复制的抑制,导致ATM-Chk2轴的DNA损伤信号传导和诱导细胞死亡。GANT61抑制Gli1的DNA结合能力。GANT61抑制hedgehog信号,IC50为5 μ M,比作用于其他通路选择性高(如TNF信号/NF- κ B激活,糖皮质激素受体基因转录,及Ras-Raf-Mek-Mapk级联)。

细胞实验

BrdU Incorporation Assay. Subconfluent cells are grown in reduced FBS (2.5%) for 48 h in the presence of 5 μ M test compound (or DMSO) on white 96-well plates with clear bottom. Subsequently, cells are labeled for 2 h with BrdU, fixed, and analyzed.(Only for Reference)

描述

GANT 61 is an inhibitor for Gli1 and Gli2.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years