



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **SAG hydrochloride**

CAS 号: **2095432-58-7**

产品货号: **S89159**

生物活性:

Description	SAG hydrochloride 是一种有效的 Smoothened (Smo) 受体激动剂 (EC50=3 nM; Kd=59 nM)。SAG hydrochloride 可激活 Hedgehog 信号通路并抵消 Cyclopamine (HY-17024) 对 Smo 的抑制作用。																				
IC50 & Target	EC50: 3 nM (Smo)[1]																				
In Vitro	SAG hydrochloride (0.1 nM-100 μ M; 30 h) 在 Shh-LIGHT2 细胞中诱导萤火虫荧光素酶表达, EC50 为 3 nM, 然后在更高浓度下抑制表达[1]。 SAG hydrochloride (1-1000 nM; 1 h) 竞争 BODIPY-cyclopamine 与表达 Smo 的 Cos-1 细胞的结合, 对 SAG hydrochloride /Smo 复合物的表观解离常数 (Kd) 为 59 nM[1]。 SAG hydrochloride (100 nM) 抑制 ShhN 诱导的 Robotnikinin 通路激活的抑制作用[2]。 SAG hydrochloride (250 nM; 48 h) 显著增加 MDAMB231 细胞中 SMO mRNA 和蛋白的表达 [3]。 SAG hydrochloride (250 nM; 24 和 48 h) 增加 CAXII MDAMB231 细胞在含氧量正常和低氧条件下 24 h 的 mRNA 表达[3]。 SAG hydrochloride (250 nM; 24 h) 增加 MDAMB231 细胞迁移[3]。.																				
In Vivo	在 CD-1 小鼠中, SAG hydrochloride (1.0 mM) 主要在缺损边界诱导更多的成骨, 并在八周时间点显著增加 BV/TV[4]。 SAG hydrochloride (15- 20 mg/kg; ip) 在小鼠中以剂量依赖性方式普遍诱导轴前多指畸形[5]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td colspan="3">Pregnant C57BL/6J mice[5]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td colspan="3">15, 17, 20 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td colspan="3">A single i.p.</td></tr><tr><td>Result:</td><td colspan="3">Effective in ca. 80% of the embryos and increased Gli1 and Gli2 mRNA expression in the limb bud, with Gli1 mRNA being the most upregulated at the dose of 20 mg/kg</td></tr></table>				Animal Model:	Pregnant C57BL/6J mice[5]			Dosage:	15, 17, 20 mg/kg			Administration:	A single i.p.			Result:	Effective in ca. 80% of the embryos and increased Gli1 and Gli2 mRNA expression in the limb bud, with Gli1 mRNA being the most upregulated at the dose of 20 mg/kg			
Animal Model:	Pregnant C57BL/6J mice[5]																				
Dosage:	15, 17, 20 mg/kg																				
Administration:	A single i.p.																				
Result:	Effective in ca. 80% of the embryos and increased Gli1 and Gli2 mRNA expression in the limb bud, with Gli1 mRNA being the most upregulated at the dose of 20 mg/kg																				
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 25 mg/mL (47.48 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 21.67 mg/mL (41.16 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> SolventMassConcentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.8993 mL</td><td>9.4963 mL</td><td>18.9926 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.3799 mL</td><td>1.8993 mL</td><td>3.7985 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1899 mL</td><td>0.9496 mL</td><td>1.8993 mL</td></tr></table> *请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂:				Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	1.8993 mL	9.4963 mL	18.9926 mL	5 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7985 mL	10 mM	0.1899 mL	0.9496 mL	1.8993 mL
Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg																	
	1 mM	1.8993 mL	9.4963 mL	18.9926 mL																	
	5 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7985 mL																	
	10 mM	0.1899 mL	0.9496 mL	1.8993 mL																	



	——为保证实验结果的可靠性,澄清的储备液可以根据储存条件,适当保存;体内实验的工作液,建议您现用现配,当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比;如在配制过程中出现沉淀、析出现象,可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (4.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 21.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中,混合均匀;再向上述体系中加入 50 μL Tween-80,混合均匀;然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠,溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL,可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (4.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 21.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中,混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中,完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (4.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液,此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 21.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中,混合均匀。
参考文献	[1]. Chen JK, et al. Small molecule modulation of Smoothened activity. Proc Natl Acad Sci U S A. 2002 Oct 29;99(22):14071-6. [2]. Stanton BZ, et al. A small molecule that binds Hedgehog and blocks its signaling in human cells. Nat Chem Biol. 2009 Mar;5(3):154-6. [3]. Guerrini G, et, al. Inhibition of smoothened in breast cancer cells reduces CAXII expression and cell migration. J Cell Physiol. 2018 Dec; 233(12): 9799-9811. [4]. Lee S, et al. Combining Smoothened Agonist (SAG) and NEL-like protein-1 (NELL-1) Enhances Bone Healing. Plast Reconstr Surg. 2017 Feb 13. [5]. Fish EW, et al. Preaxial polydactyly following early gestational exposure to the smoothened agonist, SAG, in C57BL/6J mice. Birth Defects Res A Clin Mol Teratol. 2016 Nov 1.
完整储备液配制表: 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80° C 储存时,请在 6 个月内使用, -20° C 储存时,请在 1 个月内使用。	



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO / H ₂ O	1 mM	1.8993 mL	9.4963 mL	18.9926 mL	47.4816 mL
	5 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7985 mL	9.4963 mL
	10 mM	0.1899 mL	0.9496 mL	1.8993 mL	4.7482 mL
	15 mM	0.1266 mL	0.6331 mL	1.2662 mL	3.1654 mL
	20 mM	0.0950 mL	0.4748 mL	0.9496 mL	2.3741 mL
	25 mM	0.0760 mL	0.3799 mL	0.7597 mL	1.8993 mL
	30 mM	0.0633 mL	0.3165 mL	0.6331 mL	1.5827 mL
	40 mM	0.0475 mL	0.2374 mL	0.4748 mL	1.1870 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。

源叶