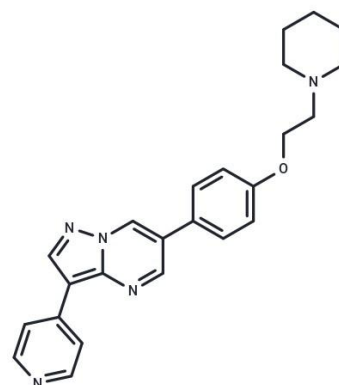


Dorsomorphin(AMPK 抑制剂)

货号: RPM0022

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	Dorsomorphin(AMPK 抑制剂)
别称/Synonyms:	Compound C, BML-275
CAS 号/CAS NO.:	866405-64-3
化学式/Formula:	C ₂₄ H ₂₅ N ₅ O
分子量/M.Wt:	399.49
外观/Appearance:	固体
保存条件/Storage:	Powder: -20°C, 3 年 Insolvent: -80°C, 1 年



◆ 溶解信息

溶解度/Solubility:	DMSO:	1.33 mg/mL (3.34 mM), 建议加热并超声。
	10% DMSO+90% Saline:	0.13 mg/mL (0.33 mM), 现配现用。

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5032 mL	12.516 mL	25.0319 mL
5 mM	0.5006 mL	2.5032 mL	5.0064 mL
10 mM	0.2503 mL	1.2516 mL	2.5032 mL
50 mM	0.0501 mL	0.2503 mL	0.5006 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	Dorsomorphin(AMPK 抑制剂) 是一种 AMPK 抑制剂 (Ki=109 nM), 具有选择性和 ATP 竞争性, 可以抑制 BMPI 型受体 ALK2、ALK3 和 ALK6, 可诱导自噬, 具有抗肿瘤活性。
靶点活性/Targets (EC ₅₀)	AMPK, Autophagy, TGF-beta/Smad
体外活性/In vitro	ATL 患者来源的 PBMCs 细胞用 Dorsomorphin (5-25 μM) 处理 24 h, 使用 Flow Cytometry 检测细胞凋亡情况。结果显示 Dorsomorphin 以剂量依赖的方式增加了急性慢性型 ATL 患者 PBMC 中早期凋亡细胞的频率 ^[1] 。
体内活性/In vivo	将 Dorsomorphin (10 mg/kg) 单次腹腔注射给 iron-dextran 处理的 C57BL/6 小鼠。结果显示 Dorsomorphin 消除了 iron-dextran 引起的铁介导的肝脏 SMAD1/5/8 磷酸化的增加 ^[2] 。

激酶实验/Kinase Assay	将 HT1080 细胞接种在 24 孔板中, 并在存在或不存在葡萄糖或 10mM 2DG 的情况下用 Dorsomorphin 处理 2 小时。在 24 孔板中接种并用 UPR 抑制剂处理来制备过表达野生型和显性失活 AMPK α 1 的 HT1080 细胞。用细胞裂解缓冲液裂解细胞。使用 CycLex AMPK 激酶测定试剂盒测定对样品对照的相对 AMPK 激酶活性 (重复测定的平均值 $\pm$ SD) ^[1] 。
细胞实验/Cell Research	在存在或不存在 10mM 2DG 或 1 μ g/ mL 衣霉素作为应激源的情况下, 用不同浓度的 Dorsomorphin, Versipelostatin 和苯乙双胍处理 HeLa 和 786-O 细胞。在存在或不存在 10mM 2DG 的情况下, 用各种浓度的 UPR 抑制剂处理 786-O 细胞 24 小时。然后用新鲜生长培养基替换培养基, 并将细胞再培养 15 小时。随后, 将 MTT 添加到培养基中, 并确定每个孔的吸光度。在存在或不存在葡萄糖的情况下, 在 12 孔板中用不同浓度的 Dorsomorphin 和苯乙双胍处理 HT1080 细胞 18 小时, 接种在 96 孔板中的生长培养基中, 然后培养, 计算相对细胞存活率。使用等效线法 ^[3] 分析药物组合在产生 80% 细胞生长抑制 (IC ₈₀) 的浓度下的作用。
动物实验/Animal Research	12 周龄小鼠通过尾静脉注射 0.2g / kg 葡聚糖或 0.2g / kg 铁-葡聚糖 USP。葡聚糖仅注射载体, 而铁-葡聚糖注射载体或 Dorsomorphin (10mg / kg)。注射后 1 小时, 杀死小鼠并将肝脏片段收集在 500 μ L SDS-裂解缓冲液中并机械均化。通过 SDS-PAGE 分离 20 μ L 肝脏提取物并进行免疫印迹。使用均质化的小鼠肝脏的 Trizol 收获总 RNA (注射后 6 小时, 单次腹膜内剂量的 Dorsomorphin (10mg / kg) 或 DMSO) ^[2] 。

◆ 参考文献

[1] Aikawa A, et al. Cell death induced by dorsomorphin in adult T-cell leukemia/lymphoma is AMPK-independent. FEBS J. 2020 Sep;287(18):4005-4015.

[2] Yu PB, et al. Dorsomorphin inhibits BMP signals required for embryogenesis and iron metabolism. Nat Chem Biol. 2008 Jan;4(1):33-41.[3] Wen HC, et al. PMA inhibits endothelial cell migration through activating the PKC- δ /Syk/NF- κ B-mediated up-regulation of Thy-1. Sci Rep. 2018 Nov 2;8(1):16247.

[3] Saito S, et al. Compound C prevents the unfolded protein response during glucose deprivation through a mechanism independent of AMPK and BMP signaling. PLoS One. 2012;7(9):e45845.

◆ 注意事项

1. 请在收到本产品后立即按照说明书中推荐的条件保存, 使用前进行离心, 使粉末充分沉降于管底。
2. 请根据实验目的及本产品的溶解性, 选择相应的溶剂配制成高浓度母液后使用, 最佳工作浓度请参考相关文献通过实验摸索优化, 本说明书中的数据来源于公开文献, 仅供参考。
3. 本产品仅供科研使用, 不可用于诊断或治疗领域。
4. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。