

#MS1002

EPZ5676

CAS No. 1380288-87-8

 5mg 25mg

Abmart

Orders

021-34695924

orders@ab-mart.com

Support

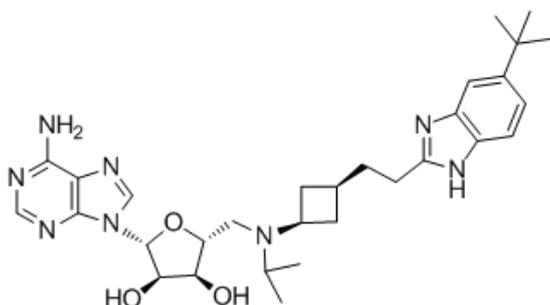
400-6123-828

support1@ab-mart.com

Web

www.ab-mart.com.cn

结构式



化学数据

分子量	562.71	储存条件	3 年-20°C 粉状
化学式	C ₃₀ H ₄₂ N ₈ O ₃		2 年-80°C 溶于溶剂
CAS 号	1380288-87-8	别名	N/A
化学名	9H-Purin-6-amine, 9-[5-deoxy-5-[[cis-3-[2-[6-(1,1-dimethylethyl)-1H-benzimidazol-2-yl]ethyl]cyclobutyl](1-methylethyl)amino]-β-D-ribofuranosyl]-		
Solubility (25°C) *	体外	DMSO	100 mg/mL warmed with 50°C water bath (177.71 mM)
		Ethanol	100 mg/mL warmed with 50°C water bath (177.71 mM)
		Water	Insoluble
	体内（现配现用）	2% DMSO+30% PEG 300+5% Tween 80+ddH ₂ O	5mg/mL

* <1 mg/ml means slightly soluble or insoluble.

* Please note that Selleck tests the solubility of all compounds in-house, and the actual solubility may differ slightly from published values.

This is normal and is due to slight batch-to-batch variations.

制备储备液

浓度 / 溶剂体积 / 质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7771 mL	8.8856 mL	17.7711 mL
5 mM	0.3554 mL	1.7771 mL	3.5542 mL
10 mM	0.1777 mL	0.8886 mL	1.7771 mL
50 mM	0.0355 mL	0.1777 mL	0.3554 mL

生物活性

产品描述	Pinometostat (EPZ5676)是一种蛋白甲基转移酶 DOT1L 的 S-腺苷甲硫氨酸(SAM)竞争性抑制剂，无细胞试验中 K_i 为 80 pM，比作用于所有其他测试的 PMTs 选择性高 37000 倍以上，抑制肿瘤中 H3K79 甲基化。Phase 1。
靶点	DOT1L (Cell-free assay) 80 pM(Ki)
体外研究	EPZ-5676 减少了 MV4-11 细胞中 H3K79 双甲基化, IC50 是 2.6 nM。EPZ-5676 浓度和时间依赖性降低 H3K79 甲基化，而对其他组蛋白位点无作用，这导致在 MLL 重排的白血病细胞中抑制的关键靶的 MLL 基因并选择性的凋亡细胞杀伤。EPZ-5676 抑制 MLL-AF4 重新排列细胞系 MV4-11 的增殖，IC50 为 9 nM。
体内研究	在 MLL 重排的白血病异种移植模型中，EPZ-5676 连续静脉滴注 21 天后导致剂量依赖性的抗肿瘤活性。在最高剂量为 70.5 毫克/公斤/天时，肿瘤完全消退后治疗停止，长达 32 天都没有肿瘤再生长。在 EPZ-5676 治疗的大鼠中，无显著体重减轻或明显毒性出现。
特征	

如果需要长期保存，请于零下二十度低温保存。

禁止用于人体及治疗！

特定的存储和包装每个产品的信息在产品说明书上都有注明。大多数产品，在推荐的条件下存储可稳定保存两年。产品有时建议的储存温度不同，大多数建议储存在-20°C，抑制剂属于化学试剂，可在常温下运输储存两周左右。即使如此，我们保证产品的出货量将保持产品质量的条件下，一般都会放入冰袋。望阁下收到产品后，请按照产品数据表建议适当存储。