

#MS1027

EPZ005687

CAS No. 1396772-26-1

 5mg 25mg


Orders

021-34695924

orders@ab-mart.com

Support

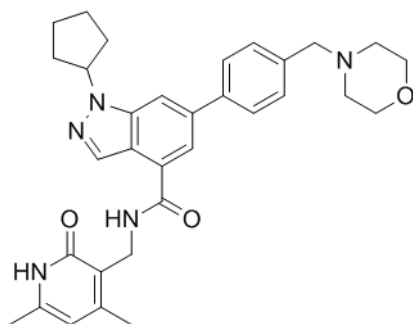
400-6123-828

support1@ab-mart.com

Web

www.ab-mart.com.cn

结构式



化学数据

分子量	539.67	储存条件	3年-20°C 粉状
化学式	C ₃₂ H ₃₇ N ₅ O ₃		2年-80°C 溶于溶剂
CAS号	1396772-26-1	别名	N/A
化学名	1H-Indazole-4-carboxamide, 1-cyclopentyl-N-[(1,2-dihydro-4,6-dimethyl-2-oxo-3-pyridinyl)methyl]-6-[4-(4-morpholinylmethyl)phenyl]-		
Solubility (25°C) *	体外	DMSO	2 mg/mL (3.7 mM)
		Water	Insoluble
		Ethanol	Insoluble
	体内 (现配现用)		

* <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	1.8530 mL	9.2649 mL	18.5298 mL
5 mM	0.3706 mL	1.8530 mL	3.7060 mL
10 mM	0.1853 mL	0.9265 mL	1.8530 mL

生物活性

产品描述	EPZ005687 是一种有效的, 选择性 EZH2 抑制剂, 无细胞试验中 K_i 为 24 nM, 比作用于 EZH1 选择性高 50 倍, 比作用于 15 种其他蛋白甲基转移酶选择性高 500 倍。
靶点/IC50	EZH2, IC50: 24 nM(Ki)
体外研究	EPZ005687 抑制 PRC2 酶活性, 这种作用具有浓度依赖性, IC50 为 54 nM。EPZ005687 直接抑制 PRC2 酶活性, 不通过破坏 PRC2 亚基之间的蛋白-蛋白相互作用而发挥功能。EPZ005687 结合到 EZH2 SET 结构域的 SAM 口袋, 是 SAM 竞争性的 EZH2 酶活性抑制剂。EPZ005687 作用于含野生型和 Tyr641 突变型 EZH2 的 PRC2 复合体的亲和力是相似的 (在 2 倍的范围内), 而作用于 A677G 突变体酶则具有更显著的较高亲和力 (5.4 倍)。EPZ005687 作用于多种不同的淋巴瘤细胞, 减少 H3K27 甲基化。对含杂合 Tyr641 或 Ala677 突变型细胞具有强大的杀伤力, 对野生型细胞增殖的影响最低。EPZ005687 增加了细胞周期的 G1 期, 相应地, 降低 S 及 G2/M 期。EPZ005687 作用于 Tyr641 突变的淋巴瘤细胞系, 使已知的 EZH2 靶基因脱抑制, 且影响 EZH2 Tyr641 突变特异性抑制的基因。
体内研究	

细胞实验

细胞系	OCI-LY19, WSU-DLCL2, Pfeiffer
浓度	~10 μ M
处理时间	11 天
方法	根据线性对数期生长, 测定每组细胞的接种密度。进行细胞计数, 实验第 4 和 7 天, 在含 EPZ005687 的新鲜培养基中, 细胞分裂回原来的接种密度。

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。