

### 3-deazaneplanocin A HCl ; 3-Deazaneplanocin A (DZNep)

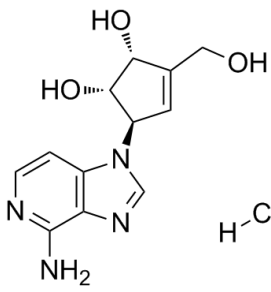
产品编号：MB0770

质量标准：>98%,BR

包装规格：1MG；5MG

产品形式：白色至米色粉末

#### 基本信息

分子式	C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> .HCl	结 构 式	
分子量	298.73		
CAS No.	120964-45-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 52 mg/mL (174.07 mM) Water ≥5 mg/mL Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介：**3-Deazaneplanocin A hydrochloride 是一种有效的组蛋白甲基转移酶 (EZH2) 抑制剂。

**别名：**3-去氮腺嘌呤 A；盐酸 3-去氮腺嘌呤；

(-)-1-[(1R,4R,5S)-3-(Hydroxymethyl)-4,5-dihydroxy-2-cyclopenten-1-yl]4-aminoimidazo[4,5-c]pyridine hydrochloride, DZNep hydrochloride

#### 物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

溶解性：.....DMSO 52 mg/mL (174.07 mM)；Water ≥5 mg/mL；Ethanol Insoluble

纯度：.....>98%,BR

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

#### 生物活性

<b>产品描述</b>	3-deazaneplanocin A (DZNep)HCl，一种腺苷类似物，是竞争性 S-adenosylhomocysteine hydrolase 抑制剂，无细胞试验中 K <sub>i</sub> 为 50 pM。
<b>特性</b>	Carbocyclic analog of adenosine, and acts as anti-tumor and anti-virus inhibitor of EZH2.
<b>靶点</b>	S-adenosylhomocysteine hydrolase 50 pM(K <sub>i</sub> )
<b>体外研究</b>	3-Deazaneplanocin A (1.0 μM) 作用于人类急性髓细胞白血病 OCI-AML3 细胞，导致 G0/G1 期 (58.5%) 细胞积累显著增加，从而导致 S 期 (35.2%) 和 G2/M 期 (6.3%) 细胞数量减少。 3-Deazaneplanocin A (1.0 μM) 作用于 OCI-AML3 (~50%) 和 HL-60 细胞(~50%)，诱导细胞凋亡处理 48 小时，细胞剂量生长降低 90%以上。3-Deazaneplanocin A 作用于 HL-60 和

	<p>OCI-AML3 细胞及原代 AML 细胞,降低 EZH2 水平,抑制组蛋白 H3 在赖氨酸 27 位点的三甲基化。3-Deazaneplanocin A 处理,诱导 p16, p21, p27, 和 FBXO32,而降低 cyclin E 和 HOXA9 水平。500 nM 3-Deazaneplanocin A 处理 48 小时,诱导 HL-60 细胞分化为 CD11b<sup>+</sup>细胞近 3 倍。</p> <p>3-Deazaneplanocin A 作用于几种病毒类型,具有极好的活性。3-Deazaneplanocin A 有效作用于 L929 细胞的水疱性口炎病毒, H.Ep-2 的副流感病毒, vero 细胞的牛痘和黄热病病毒, IC50 分别为 0.2, 3.6, 2.1 和 2.9 <math>\mu\text{g}/\text{mL}</math>。3-Deazaneplanocin A 作用于美国 Leishmania (L mexicana and L brasiliensis) 株,具有强的抗什曼原病的疗效,平均 ID50 为 96 ng/mL,而即使浓度高达 10 <math>\mu\text{g}/\text{mL}</math>,也不抑制一些 T. cruzi 和 T. rangeli 菌株。3-Deazaneplanocin A 按 200 ng/mL 剂量处理,4 天后,通过前鞭毛体抑制 S-腺苷-L-3H-甲基蛋氨酸和 3-胸苷渗透。</p> <p>3-Deazaneplanocin A 按 100 ng/mL 剂量处理,消除约 56%感染人巨噬细胞的 L mexicana 和 L brasiliensis。</p>
<b>体内研究</b>	<p>3-Deazaneplanocin A 在体内具有抗白血病活性。3-Deazaneplanocin A(1 mg/kg)处理移植 AML 细胞的小鼠,显著延长小鼠的生存期,与对照组(36 天)相比,中位生存期为 43 天,与 10 mg/kg pan-HDAC 抑制剂(HDI) Panobinostat(中位生存期 52 天)联用可进一步提高治疗。</p> <p>3-Deazaneplanocin A 按 8 mg/kg 剂量处理牛痘病毒,在体内显示抗病毒活性。</p> <p>3-Deazaneplanocin A 每天按 0.5 到 1.5 mg/kg 剂量处理接种 L. b. guyanensis 的近交 BALB/c 小鼠,显著降低皮肤利什曼病的感染。3-Deazaneplanocin A 处理感染 Ebola 病毒的小鼠,显著诱导干扰-<math>\alpha</math> 的产量增加。3-Deazaneplanocin A(感染后按 2 mg/kg 剂量皮下注射)处理感染 1000 pfu (30 000 LD50) 小鼠适应性 EBO-Z 的小鼠,防止死亡。3-Deazaneplanocin A 处理第 1 天降低平均血清病毒滴度,与安慰剂对照组相比,第 2 天降低 100 倍,第 3 天降低 100000 倍,产生的平均血清 IFN-<math>\alpha</math> 水平在第 2 天为 1420 pg/mL,第 3 天为 1830 pg/mL。</p>

**美仑相关产品推荐**

MB4405	EPZ6438
MB4407	GSK126
MB3883	AZD6482
CL-11196	BAG956
MB3434	CH5132799
MB3885	CUDC-907
MB3870	GDC-0980 (RG7422)
MB3891	GSK1059615
MB5322	PF-4989216
MB3864	PI-103
CL-10040	TG100713
MB5302	VS-5584
MB5319	XL-147

**用途及描述:** 科研试剂,广泛应用于分子生物学,药理学等科研方面,严禁用于人体。3-Deazaneplanocin A (DZNep)是一种 s-腺苷同型半胱氨酸水解酶抑制剂和组蛋白甲基转移酶 EZH2 抑制剂。通过抑制 EZH2 的表达,激活被抑制的肿瘤抑制基因,诱导细胞凋亡。用于肿瘤、癌症等相关科研领域研究。

**储液配置**

	1 mg	5 mg	10 mg
-------------------------------------------------------------------------------------	------	------	-------

1 mM	3.3475 mL	16.7375 mL	33.4750 mL
5 mM	0.6695 mL	3.3475 mL	6.6950 mL
10 mM	0.3348 mL	1.6738 mL	3.3475 mL
50 mM	0.0670 mL	0.3348 mL	0.6695 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>S-腺苷同型半胱氨酸水解酶活性测定:</b>                  AdoHcyase 检测的反应混合物有 0.5 mL, 50 mM 磷酸钾 (pH 7.6), 5 mM 二硫苏糖醇, 1 mM EDTA, 10%甘油, 和酶。L-[8-<sup>14</sup>C]AdoHcy 用作底物, 包括 5 个单位小牛肠腺苷脱氨酶。加入 100 μL 5 M 甲酸终止反应, 然后反应混合物加到 SP-Sephadex C-25 柱(0.8×2.5 cm)中, 在 0.1 M 甲酸中平衡。每个试管使用 0.5 mL 0.1 M 甲酸进行漂洗。3.5 mL 0.1 M 甲酸加到闪烁瓶中, 从柱中洗脱形成<sup>14</sup>C肌苷。加入 10mL 闪烁液后测定放射性。使用的酶量约为 105 pU, 或 75 ng 纯化的酶。在 37°C 下, 1 分钟内形成 1 pmol 产物需要的酶量为一个单位。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 人类急性髓细胞白血病 HL-60 细胞  <b>Concentrations:</b> ~1 μM  <b>Incubation Time:</b> 2 天  <b>Method:</b>                  使用指定浓度的 3-Deazaneplanocin A 处理细胞 48 小时。处理后, 收集细胞, 并用 PBS 洗涤两次, 约 500 个细胞接种到完全 Methocult 中, 在 37°C 下含 5% CO<sub>2</sub> 的环境中培养 7 到 10 天。使用结晶紫进行细胞染色, 通过溶解结晶紫染料在 10% 乙酸中, 然后测量 450nm 处的吸光度, 而测定相对细胞集落密度。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 人类急性髓细胞白血病移植瘤 HL-60  <b>Formulation:</b> --  <b>Dosages:</b> 1 mg/kg  <b>Administration:</b> 实验第 7 天开始, 每周腹腔处理两次 (周二-周四), 持续 2 周</p>

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。