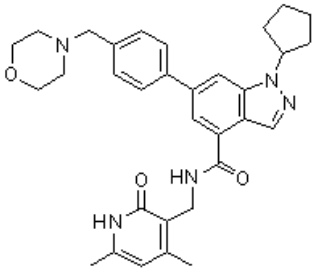


EPZ-005687 ; EPZ005687

产品编号：MB3684
 质量标准：>98%,BR
 包装规格：5MG;25MG
 产品形式：粉状

基本信息

分子式	C32H37N5O3	结构式	
分子量	539.67		
CAS No.	1396772-26-1		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：2 mg/mL (3.7 mM)		
	Water Insoluble		
	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：EPZ005687 是一种有效的、选择性的 EZH2 抑制剂， K_i 值为 24 nM，对其选择性是对 EZH1 的 50 倍，对其他 15 种甲基转移酶的 500 倍。

别名：1H-Indazole-4-carboxamide,

1-cyclopentyl-N-[(1,2-dihydro-4,6-dimethyl-2-oxo-3-pyridinyl)methyl]-6-[4-(4-morpholinylmethyl)phenyl]-

物理性状及指标：

外观：.....类白色至黄色粉末

溶解性：.....DMSO：2 mg/mL (3.7 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

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	<table border="1"> <tr> <td>EZH2 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>24 nM(K_i)</td> </tr> </table>	EZH2 (Cell-free assay)	24 nM(K_i)
EZH2 (Cell-free assay)			
24 nM(K_i)			
体外研究	EPZ005687 抑制 PRC2 酶活性，这种作用具有浓度依赖性， IC_{50} 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。
--	---

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4405	EPZ6438
MB4407	GSK126

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。EPZ005687 是一种有效的，选择性 EZH2 抑制剂，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。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8530 mL	9.2649 mL	18.5298 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>生化酶学检验:</p> <p>化合物与每孔 40 μL 5 nM PRC2(50 μL 中的实验终浓度为 4 nM) 在 1X 实验缓冲液(20 mM Bicine [pH 7.6], 0.002% Tween-20, 0.005% Bovine Skin Gelatin 和 0.5 mM DTT)中温育 30 分钟。每孔 10 μL 底物混合物包括实验缓冲液 3H-SAM, 未标记的 SAM, 加入代表组蛋白 H3 残基 21-44 的肽 (包含 C-末端生物素, 附加到 C-末端酰胺封端的赖氨酸上), 开始反应, 终反应混合物中的每种底物都处于其各自的 Km 值, 这种实验形式被称为“平衡条件”。终浓度底物与每组酶反应指定的甲基化状态的底物肽在室温下温育 90 分钟, 然后每孔使用 10 μL 600 μM 未标记的 SAM 淬灭, 然后转移到 384 孔闪光板上, 30 分钟后进行洗涤。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: OCI-LY19, WSU-DLCL2, Pfeiffer</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 11 天</p> <p>Method: 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。</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。