

## EPZ-5676 ; EPZ5676

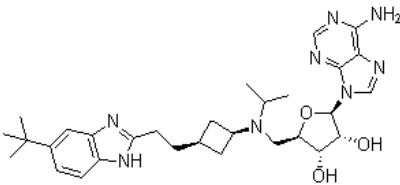
产品编号：MB3687

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

### 基本信息

分子式	C30H42N8O3	结 构 式	
分子量	562.71		
CAS No.	1380288-87-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL warmed (177.71 mM) Water Insoluble Ethanol : 92 mg/mL warmed (163.49 mM)		
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：**EPZ-5676 是有效的 DOT1L 组蛋白甲基转移酶抑制剂， $K_i$  为 80 pM。

**别名：**EPZ-5676;EPZ5676;EPZ 5676; Pinometostat;

9-[5-Deoxy-5-[[cis-3-[2-[6-(1,1-dimethylethyl)-1H-benzimidazol-2-yl]ethyl]cyclobutyl](1-methylethyl)amino]-beta-D-ribofuranosyl]-9H-purin-6-amine

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL warmed (177.71 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 92 mg/mL warmed (163.49 mM)

含量：.....>98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	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。		
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>DOT1L (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>80 pM(<math>K_i</math>)</td> </tr> </table>	DOT1L (Cell-free assay)	80 pM( $K_i$ )
DOT1L (Cell-free assay)			
80 pM( $K_i$ )			
<b>体外研究</b>	EPZ-5676 减少了 MV4-11 细胞中 H3K79 双甲基化， $IC_{50}$ 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， $IC_{50}$ 为 9 nM。		

<b>体内研究</b>	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。
-------------	---

**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)**

MB4407	GSK126
MB3680	RG108

**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。EPZ-5676 是氨基核苷类 DOT1L 组蛋白甲基转移酶抑制剂，比对其它多种 PMTs 的抑制性高 37000 倍。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	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

**【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。