



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **EPZ005687**
CAS 号: **1396772-26-1**
产品货号: **S42481**

生物活性:				
Description	EPZ005687 是一种有效的, 选择性的 EZH2 抑制剂, Ki 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.			
IC50 & Target[1]	EZH2 24 nM (Ki)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	G-401	EC ₅₀	2.9 μ M	Inhibition of methyltransferase activity of EZH2 in human G401 cells assessed as H3K27 trimethylation after 4 hrs by ELISA Inhibition of methyltransferase activity of EZH2 in human G401 cells assessed as H3K27 trimethylation after 4 hrs by ELISA
In Vitro	EPZ005687 显示 PRC2 酶活性的浓度依赖性抑制, IC50 值为 54 nM。EPZ005687 特异性抑制淋巴瘤细胞中的 H3K27 甲基化。EPZ005687 对携带 EZH2Y641F 的细胞系的增殖具有显著影响。EPZ005687 减少突变体而非野生型 EZH2 淋巴瘤细胞的增殖[1]。EPZ005687 (0.5、1、5 和 10 μ M) 以剂量依赖性方式诱导 U937 细胞明显凋亡。EPZ005687 对 U937 细胞增殖有明显抑制作用, 对 NBMC34+细胞增殖抑制作用较弱。EPZ005687 诱导 G1 期阻断并降低 U937 细胞中处于 S 期的细胞百分比。此外, EPZ005687 对 U937 细胞的 H3K27 甲基化有明显的去除作用, 但对 NBMC34+细胞的 H3K27 甲基化几乎没有影响[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 10 mg/mL (18.53 mM); 超声助溶 (<60° C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	1.8530 mL	9.2649 mL
		5 mM	0.3706 mL	1.8530 mL
		10 mM	0.1853 mL	0.9265 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一			



	请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 1 mg/mL (1.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1 mg/mL (1.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1 mg/mL (1.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Knutson SK, et al. A selective inhibitor of EZH2 blocks H3K27 methylation and kills mutant lymphoma cells. Nat Chem Biol. 2012;8(11):890-6. [2]. Tang SH, et al. Effects of H3K27 methylation inhibitor EPZ005687 on apoptosis, proliferation and cell cycle of U937 cells and normal CD34 positive cells. Zhongguo Shi Yan Xue Ye Xue Za Zhi. 2014 Dec;22(6):1561-6.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80℃, 2 years; -20℃, 1 year. -80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8530 mL	9.2649 mL	18.5298 mL	46.3246 mL
	5 mM	0.3706 mL	1.8530 mL	3.7060 mL	9.2649 mL
	10 mM	0.1853 mL	0.9265 mL	1.8530 mL	4.6325 mL
	15 mM	0.1235 mL	0.6177 mL	1.2353 mL	3.0883 mL