



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: **EML 425**
CAS 号: **1675821-32-5**
产品货号: **T20418**

生物活性:				
Description	EML425 是一种有效的选择性 CREB 结合蛋白 (CBP)/p300 抑制剂。IC50 为 2.9 和 1.1 μ M。			
IC50 & Target	IC50: 1.1 μ M (p300), 2.9 μ M (CBP)[1]			
In Vitro	EML 425 (EML425, Compound 7h) 是一种有效的选择性可逆 CBP/p300 抑制剂, 与乙酰辅酶 A 和组蛋白 H3 肽无竞争性, 并具有良好的细胞渗透性。EML 425 抑制 p300 和 CBP (IC50 值分别为 2.9 和 1.1 μ M), 同时对一般控制非去阻遏酶 5 (GCN5) 和 p300/CBP 相关因子几乎没有活性 (PCAF)。EML 425 诱导 U937 细胞中赖氨酸 H4K5 和 H3K9 乙酰化的显著和时间依赖性降低。EML 425 被证明是一种可逆抑制剂, 与乙酰辅酶 A 和组蛋白 H3 肽没有竞争性, 并且能够结合游离酶和酶-底物复合物, 即使亲和常数不相等。最佳得分对接姿势表明 EML 425 的结合位点是位于底物赖氨酸结合沟附近并靠近乙酰化位点的替代口袋[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 250 mg/mL (567.55 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.2702 mL	11.3510 mL
		5 mM	0.4540 mL	2.2702 mL
		10 mM	0.2270 mL	1.1351 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.72 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。			
参考文献	[1]. Milite C, et al. A novel cell-permeable, selective, and noncompetitive inhibitor of KAT3 histone acetyltransferases from a combined molecular pruning/classical isosterism approach. J Med Chem. 2015 Mar			



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

26;58(6):2779-98.

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°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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2702 mL	11.3510 mL	22.7020 mL	56.7550 mL
	5 mM	0.4540 mL	2.2702 mL	4.5404 mL	11.3510 mL
	10 mM	0.2270 mL	1.1351 mL	2.2702 mL	5.6755 mL
	15 mM	0.1513 mL	0.7567 mL	1.5135 mL	3.7837 mL
	20 mM	0.1135 mL	0.5675 mL	1.1351 mL	2.8377 mL
	25 mM	0.0908 mL	0.4540 mL	0.9081 mL	2.2702 mL
	30 mM	0.0757 mL	0.3784 mL	0.7567 mL	1.8918 mL
	40 mM	0.0568 mL	0.2838 mL	0.5675 mL	1.4189 mL
	50 mM	0.0454 mL	0.2270 mL	0.4540 mL	1.1351 mL
	60 mM	0.0378 mL	0.1892 mL	0.3784 mL	0.9459 mL
	80 mM	0.0284 mL	0.1419 mL	0.2838 mL	0.7094 mL
	100 mM	0.0227 mL	0.1135 mL	0.2270 mL	0.5675 mL