

GSK126

产品信息

产品名称	产品编号	规格
GSK126	51505ES08	5 mg
GSK126	51505ES25	25 mg

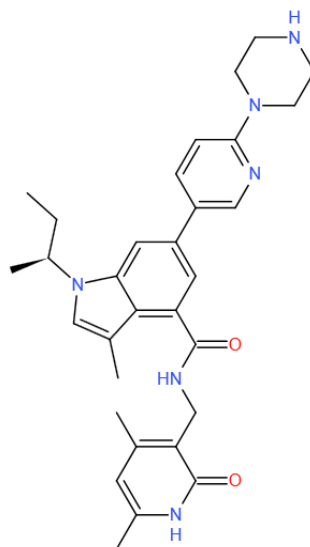
产品描述

GSK126 (GSK-126, GSK 126)是一种有效的、高选择性、S腺苷甲硫氨酸 (S-adenosyl-methionine) 竞争性的EZH2甲基转移酶抑制剂 ($K_i = 0.57 \text{ nM}$, $IC_{50} = 9.9 \text{ nM}$)。GSK126有效降低H3K27me3水平, 并再次激活沉默的PRC2靶标基因。而且, GSK126有效抑制EZH2突变型DLBCL细胞系的增殖, 显著抑制移植瘤小鼠中EZH2突变型DLBCL细胞系生长。GSK126通过下调VEGF-A表达, 从而抑制肿瘤细胞迁移, 并抑制血管生成。GSK126与5-aza-dC联合使用时, 表现出更强的抑制体内肿瘤生长的作用。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GSK-126, GSK 126
化学名 (Chemical Name)	N-[(1,2-dihydro-4,6-dimethyl-2-oxo-3-pyridinyl)methyl]-3-methyl-1-[(1S)-1-methylpropyl]-6-[6-(1-piperazinyl)-3-pyridinyl]-1H-indole-4-carboxamide
靶点 (Target)	EZH2 methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	1346574-57-9
分子式 (Molecular Formula)	$C_{31}H_{38}N_6O_2$
分子量 (Molecular Weight)	526.67
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于-20 °C, 有效期2年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放6个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件(如实验目的, 细胞种类, 培养特性等)进行摸索和优化。】

相关实验(数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验(体外研究)

为研究 GSK126 对细胞的作用, 用不同浓度的 GSK126 (18-4582 nM) 孵育 Pfeiffer 或 KARPAS-422 细胞, GSK126 以剂量依赖的方式抑制细胞增殖。^[1]

(二) 动物实验(体内研究)

体内实验中, 给 KARPAS-422 腹腔注射 GSK126 (50, 150, 300 mg/kg), 肿瘤体积明显减小, 引起显著的肿瘤消退。^[1]

参考文献

- [1] McCabe MT, et al. EZH2 inhibition as a therapeutic strategy for lymphoma with EZH2-activating mutations. *Nature* 492(7427): 108-112 (2012).
- [2] Ott HM, et al. A687V EZH2 Is a Driver of Histone H3 Lysine 27 (H3K27) Hypermethylation. *Mol Cancer Ther.* 13(12): 3062-3073 (2014).
- [3] Takeshima H, et al. Identification of coexistence of DNA methylation and H3K27me3 specifically in cancer cells as a promising target for epigenetic therapy. *Carcinogenesis.* 36(2): 192-201 (2015).
- [4] Chen YT, et al. The novel EZH2 inhibitor, GSK126, suppresses cell migration and angiogenesis via down-regulating VEGF-A. *Cancer Chemotherapy and Pharmacology* 77(4): 757-765 (2016).