

## 3-Deazaneplanocin A hydrochloride

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
3-Deazaneplanocin A hydrochloride	53282ES03	1 mg
	53282ES08	5 mg

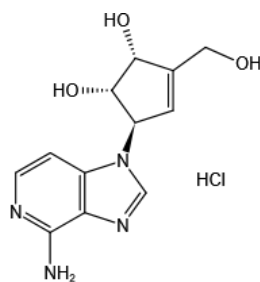
### 产品描述

3-Deazaneplanocin A hydrochloride (DZNep hydrochloride, DZNep HCl, NSC 617989 HCl, NSC617989 HCl, NSC 617989 hydrochloride, NSC617989 hydrochloride), 又称 3-去氮腺嘌呤 A 盐酸盐, 一种腺苷类似物, 具有抗病毒和抗癌活性。DZNep HCl 是 S-adenosylhomocysteine hydrolase (SAHH) 竞争性抑制剂,  $K_i$  为 50 pM; 也是 EZH2 抑制剂,  $IC_{50}$  介于 0.08-0.24  $\mu$ M 之间。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	3-Deazaneplanocin A hydrochloride, DZNep hydrochloride, DZNep HCl, NSC 617989 HCl, NSC617989 HCl, NSC 617989 hydrochloride, NSC617989 hydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	3-去氮腺嘌呤 A 盐酸盐
靶点 (Target)	EZH2
通路 (Pathway)	Epigenetics--Histone Methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	120964-45-6
分子式 (Formula)	$C_{12}H_{15}ClN_4O_3$
分子量 (Molecular Weight)	298.73
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 $H_2O$

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于  $-20^{\circ}C$ , 有效期 3 年。建议分装后  $-20^{\circ}C$  干燥保存, 避免反复冻融。

### 注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 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。】

## 使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### （一）细胞实验（体外实验）

3-Deazaneplanocin A (1  $\mu$ M)作用于 OCI-AML3 细胞, G0/G1 期细胞显著增加, S 期和 G2/M 期细胞数量减少。在 OCI-AML3 和 HL-60 细胞中, 3-Deazaneplanocin A (200 nM-2  $\mu$ M)剂量依赖方式促进细胞凋亡。<sup>[1]</sup> 在胰腺癌细胞中, 3-deazaneplanocin A hydrochloride (5  $\mu$ M)减少 EZH2 的表达; 在 PANC-1、MIA-PaCa-2 和 LPc006 细胞中 EZH2 分别减少 48%、32%和 36%。并且, DZNeP/吉西他滨组合抑制胰腺癌细胞迁移和上调 E-钙粘蛋白, 促进了细胞凋亡。<sup>[2]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在 HL-60 急性髓细胞白血病小鼠模型中, 给药 3-Deazaneplanocin A (1 mg/kg)显著延长小鼠的生存期, 中位生存期为 43 天, 与 10 mg/kg pan-HDAC 抑制剂 Panobinostat (中位生存期 52 天)联用可进一步提高治疗。<sup>[1]</sup> 3-Deazaneplanocin A (8 mg/kg)处理牛痘病毒, 在体内显示抗病毒活性。<sup>[4]</sup> 在大鼠中, DZNeP 以剂量依赖性方式引起肾毒性, 安全剂量为 10mg/kg, 表现出较短的血浆消除半衰期 (1.1 小时), 在血浆中的蛋白结合率较低(18.5%), 对红细胞的分配较低(0.78), 内在肝脏清除率较低, 有广泛的组织分布和主要的肾脏排泄(80.3%)。<sup>[5]</sup>

## 参考文献

- [1]. Fiskus W, et al. Combined epigenetic therapy with the histone methyltransferase EZH2 inhibitor 3-deazaneplanocin A and the histone deacetylase inhibitor LBH589 against human AML cells. *Blood*. 2009 Sep 24;114(13):2733-43.
- [2]. Avan A, et al. Molecular mechanisms involved in the synergistic interaction of the EZH2 inhibitor 3-deazaneplanocin A with LY 188011 in pancreatic cancer cells. *Mol Cancer Ther*. 2012 Aug;11(8):1735-46.
- [3]. Kikuchi J, et al. Epigenetic therapy with 3-deazaneplanocin A, an inhibitor of the histone methyltransferase EZH2, inhibits growth of non-small cell lung cancer cells. *Lung Cancer*. 2012 Nov;78(2):138-43.
- [4]. Tseng CK, et al. Synthesis of 3-deazaneplanocin A, a powerful inhibitor of S-adenosylhomocysteine hydrolase with potent and selective in vitro and in vivo antiviral activities. *J Med Chem*. 1989 Jul;32(7):1442-6.
- [5]. Sun F, et al. Preclinical pharmacokinetic studies of 3-deazaneplanocin A, a potent epigenetic anticancer agent, and its human pharmacokinetic prediction using GastroPlus?. *Eur J Pharm Sci*. 2015 Sep 18;77:290-302.