

HB181211

## I-BET-762 (GSK525762)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
I-BET-762 (GSK525762)	51506ES08	5 mg
I-BET-762 (GSK525762)	51506ES25	25 mg

### 产品描述

I-BET-762 是一种高效、高选择性的 BET 蛋白抑制剂,与 BET 具有很高的亲和力( $IC_{50} \approx 32.5-42.5$  nM,  $K_d = 50.5-61.3$  nM)。I-BET-762 下调 LPS 诱导的基因表达,从而引起 LPS 诱导的细胞因子和趋化因子表达降低,并阻断 BET 蛋白与乙酰化组蛋白结合,破坏炎症基因表达必不可少的染色质复合物的形成。在体内, I-BET-762 还抑制小鼠急性炎症。I-BET-762 还可以抑制骨髓癌细胞增殖,诱导细胞周期阻断,并诱导细胞凋亡。

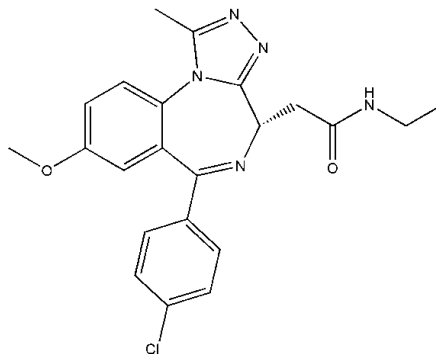
目前, I-BET-762 已用于临床 phase I 期研究。

**【该产品仅用于科研实验,不能用于人体】**

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	GSK525762
化学名 (Chemical Name)	(S)-2-(6-(4-chlorophenyl)-8-methoxy-4H-benzo[f][1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]diazepin-4-yl)-N-ethylacetamide
靶点 (Target)	BET
CAS 号 (CAS NO.)	1260907-17-2
分子式 (Molecular Formula)	$C_{22}H_{22}ClN_5O_2$
分子量 (Molecular Weight)	423.9
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）

为检测 I-BET-762 在细胞内的活性，I-BET-762 孵育 OPM-2 骨髓瘤细胞 24、48 h，I-BET-762 抑制细胞增殖，并抑制 MYC 转录。<sup>[4]</sup>

### （二）动物实验（体内研究）

在体内实验中，OPM-2 移植瘤 NOD-SCID 小鼠口服 3、10、30 mg/kg I-BET-762，服用 10、30 mg/kg I-BET-762 时小鼠体重没有明显变化，小鼠体内血浆 hLC 浓度明显降低。<sup>[4]</sup>

## 参考文献

- [1] Nicodeme E, et al. Suppression of inflammation by a synthetic histone mimic. *Nature* 468(7327): 1119-1123 (2010).
- [2] Bandukwala HS, et al. *PNAS*, 2012, 109(36), 14532-14537.
- [3] Mirguet O, et al. Discovery of Epigenetic Regulator I-BET762: Lead Optimization to Afford a Clinical Candidate Inhibitor of the BET Bromodomains. *J. Med. Chem.*, 56 (19): 7501–7515 (2013).
- [4] Chaidos A, et al. Potent antimyeloma activity of the novel bromodomain inhibitors I-BET151 and I-BET762. *Blood* 123: 697-705 (2014).