

Tazemetostat

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Tazemetostat	51504ES08	5 mg
Tazemetostat	51504ES25	25 mg

产品描述

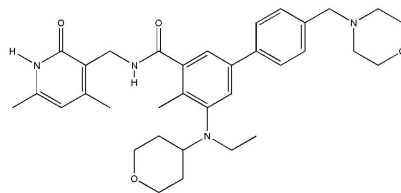
Tazemetostat (E7438, EPZ-6438, E-7438, EPZ6438)是一种有效的、选择性、具有口服生物活性的 EZH2 抑制剂($K_i=2.5$ nM), 比作用于 EZH1 选择性高 35 倍, 比作用于 14 种其他 HMT 选择性高 4500 多倍。在野生型和突变型淋巴瘤细胞中, EPZ-6438 阻断组蛋白 H3 的 Lys27 甲基化, IC_{50} 范围为 2 nM 到 90 nM。EPZ-6438 还可以引起神经元分化的基因表达和细胞周期抑制, 同时抑制 Hedgehog 通路基因, MYC 和 EZH2。另外, 在去除 SMARCB1 的 MRT 细胞中, EPZ-6438 诱导细胞凋亡和分化, 具有明显的抗增殖作用, 并引起移植瘤小鼠中肿瘤衰退。

EPZ-6438 目前处于临床II期试验, 用于治疗弥漫性大 B 细胞性淋巴瘤。

产品性

英文别名 (English Synonym)	E7438, Tazemetostat, E-7438, EPZ6438, EPZ-6438
靶点 (Target)	EZH2
通路 (Pathway)	Epigenetics--Histone Methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	1403254-99-8
分子式 (Formula)	$C_{34}H_{44}N_4O_4$
分子量 (Molecular Weight)	572.74
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

粉末直接保存于-20 °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO 后建议分装后-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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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）

为研究 EPZ-6438 对 MRT 细胞的作用，1 μ M EPZ-6438 孵育 MRT 细胞 14 天，发现，EPZ-6438 对于 SMARCB1 野生型细胞的细胞周期或细胞凋亡没有影响，而对于 G401 细胞（去除 SMARCB1），EPZ-6438 引起 G1 期比例增加，同时 S 期和 G2/M 期细胞比例降低。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

体内实验中，给 G401 移植瘤 SCID 小鼠口服 125、250、500 mg/kg EPZ-6438，21-28 天后，250、500 mg/kg EPZ-6438 显著延迟肿瘤生长。^[1]

参考文献

- [1]. Knutson SK, et al. Durable tumor regression in genetically altered malignant rhabdoid tumors by inhibition of methyltransferase EZH2. *Proc Natl Acad Sci U S A*. 2013 May 7;110(19):7922-7.
- [2]. Knutson SK, et al. Selective inhibition of EZH2 by EPZ-6438 leads to potent antitumor activity in EZH2-mutant non-Hodgkin lymphoma. *Mol Cancer Ther*. 2014 Apr;13(4):842-54.

客户使用本产品发表的科研文献（部分）

- [1] Zhen Z, Ling L, Li G, et al. EZH2/EHMT2 Histone Methyltransferases Inhibit the Transcription of DLX5 and Promote the Transformation of Myelodysplastic Syndrome to Acute Myeloid Leukemia. *Front Cell Dev Biol*. 2021 Aug 2;9:619795. IF: 6.684
- [2] Zhen Z, Xu Y, Wang S, et al. LncRNA SNHG17 promotes gastric cancer progression by epigenetically silencing of p15 and p57. *J Cell Physiol*. 2019 Apr;234(4):5163-5174. IF: 3.923