

## UNC0379

## 产品信息

产品名称	产品编号	规格
UNC0379	53597ES08	5 mg
	53597ES25	25 mg

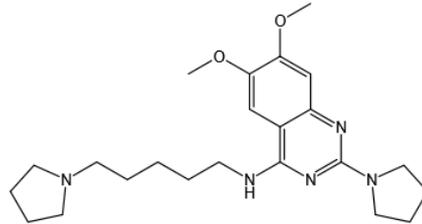
## 产品描述

UNC0379 (UNC-0379)是底物竞争性的赖氨酸甲基转移酶 SETD8 (KMT5A)选择性抑制剂, IC<sub>50</sub> 值为 7.3 μM, K<sub>D</sub> 值为 18.3 μM, 具有抗癌活性。SETD8 在多种癌症中表达, 是唯一已知的催化 H4K20 单甲基化的甲基转移酶。HK420 甲基化与多种生物过程的调节有关, 包括 DNA 损伤反应。

## 产品性

英文别名 (English Synonym)	UNC0379, UNC-0379
靶点 (Target)	SETD8 (KMT5A)
通路 (Pathway)	Epigenetics--Histone Methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	1620401-82-2
分子式 (Formula)	C <sub>23</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>
分子量 (Molecular Weight)	413.56
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

## 结构式 (Structure)



## 运输和保存方法

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

## 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）

UNC0379 (1-10  $\mu$ M, 9 days)抑制 HGSOC 细胞活力。<sup>[2]</sup> UNC0379 (10  $\mu$ M, 48 h)诱导肌成纤维细胞去分化并抑制额外的成纤维细胞向肌成纤维组织分化。<sup>[3]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在博莱霉素(BLM)诱导的肺纤维化小鼠模型中，气管内给药 UNC0379 (1 mg/kg)显著改善了与肺中胶原沉积相关的组织病理学变化，减轻肺纤维化，但并不影响小鼠支气管肺泡灌洗液中促炎细胞的数量或细胞因子的产生。<sup>[1]</sup>

### 参考文献

- [1]. Ma A, et al. Discovery of a Selective, Substrate-Competitive Inhibitor of the Lysine Methyltransferase SETD8. *J Med Chem.* 2014 Aug 14;57(15):6822-33.
- [2]. Miku Wada, et al. Epigenetic Modifier SETD8 as a Therapeutic Target for High-Grade Serous Ovarian Cancer. *Biomolecules.* 2020 Dec 16;10(12):1686.
- [3]. Keita Ugai, et al. Inhibition of the SET8 Pathway Ameliorates Lung Fibrosis Even Through Fibroblast Dedifferentiation. *Front Mol Biosci.* 2020 Aug 5;7:192.