

EPZ004777

产品信息

产品名称	产品编号	规格
EPZ004777	53598ES03	1 mg
	53598ES08	5 mg

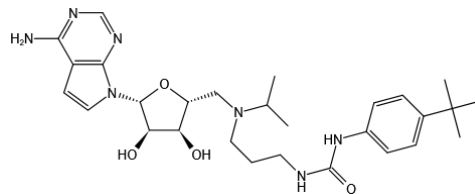
产品描述

EPZ004777 (EPZ-004777)是一种有效的 H3K79 甲基转移酶 DOT1L 选择性抑制剂, IC₅₀ 为 0.4 nM。EPZ004777 抑制白血病细胞中 H3K79 甲基化, 并阻碍关键 MLL 融合靶基因的表达, 表现出抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	EPZ004777, EPZ-004777
靶点 (Target)	DOT1L
通路 (Pathway)	Epigenetics--Histone Methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	1338466-77-5
分子式 (Formula)	C ₂₈ H ₄₁ N ₇ O ₄
分子量 (Molecular Weight)	539.67
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)

EPZ004777 证明了 DOT1L 酶活性的有效浓度依赖性抑制, IC₅₀ 为 400±100 pM。EPZ004777 显著降低了 MV4-11 和

MOLM-13 细胞的活性，但不影响 Jurkat 细胞的生长。EPZ004777 在浓度为 3 μ M 或更高时强烈抑制 MLL-AF9 转化细胞的增殖。^[1] EPZ004777 选择性抑制 MLL-AF10 和 CALM-AF10 转化小鼠骨髓细胞的增殖。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

EPZ004777 处理 MLL 白血病小鼠移植瘤模型，产生有效的抗肿瘤功效，且显著提高小鼠平均寿命，并且耐受性良好，未观察到明显的毒性。^[1]

参考文献

- [1]. Daigle SR, et al. Selective killing of mixed lineage leukemia cells by a potent small-molecule DOT1L inhibitor. *Cancer Cell*. 2011 Jul 12;20(1):53-65.
- [2]. Chen L, et al. Abrogation of MLL-AF10 and CALM-AF10-mediated transformation through genetic inactivation or pharmacological inhibition of the H3K79 methyltransferase Dot1l. *Leukemia*. 2013 Apr;27(4):813-22.