

BIX-01294 trihydrochloride

产品信息

产品名称	产品编号	规格
BIX-01294 trihydrochloride	53606ES08	5 mg
	53606ES25	25 mg

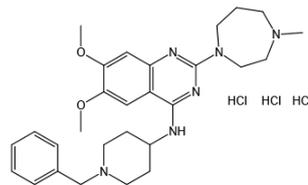
产品描述

BIX-01294 trihydrochloride (BIX01294 trihydrochloride), 又称 BIX-01294 三盐酸盐, 是一种组蛋白甲基转移酶选择性抑制剂, 特异性靶向 G9a, 阻碍 H3K9me2 生成, 对 GLP 也有微弱抑制, 具有潜在抗癌活性。BIX-01294 通过与底物赖氨酸残基 N 端的氨基酸竞争结合来抑制 G9a 和 GLP 活性, 但不影响其他组蛋白甲基转移酶活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	BIX-01294 trihydrochloride, BIX01294 trihydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	BIX-01294 三盐酸盐
靶点 (Target)	G9a histone methyltransferase
通路 (Pathway)	Epigenetics--Histone Methyltransferase
CAS 号 (CAS NO.)	1392399-03-9
分子式 (Formula)	C ₂₈ H ₄₁ Cl ₃ N ₆ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	600.02
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 H ₂ O 和 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）

BIX-01294 (2 μM , 48 h)抑制复发性乳腺癌肿瘤细胞生长；BIX-01294 (1 μM)导致 MLKL S345 磷酸化显著增加，显著上调复发性肿瘤细胞系中 p53 靶点 p21 和 Gadd45a。^[1] BIX-01294 特异性抑制 G9a (H3K9me2)，并在较小程度上抑制密切相关的 GLP 酶（主要是 H3K9me3），作用于 G9a 和 GLP， IC_{50} 分别为 1.7 μM 和 38 μM 。BIX-01294 (4.1 μM)作用于野生型 ES 细胞、小鼠胚胎成纤维细胞和 HeLa 细胞，而非缺乏 G9a 的干细胞，降低 H3K9me2 水平。^[2] BIX-01294 (1 $\mu\text{g/mL}$)导致胎儿 PASMCM 中 BrdU 掺入减少，可减少 PDGF 诱导的 PASMCM 迁移。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

在乳腺癌移植瘤小鼠中，腹腔注射 BIX-01294 (10 mg/kg)可显著降低复发肿瘤细胞的肿瘤生长，但不影响原发性肿瘤生长。^[1]

参考文献

- [1]. Nathaniel W Mabe, et al. G9a Promotes Breast Cancer Recurrence through Repression of a Pro-inflammatory Program. Cell Rep. 2020 Nov 3;33(5):108341.
- [2]. Stefan Kubicek, et al. Reversal of H3K9me2 by a small-molecule inhibitor for the G9a histone methyltransferase. Mol Cell. 2007 Feb 9;25(3):473-81.
- [3]. Yang Q, et al. BIX-01294 treatment blocks cell proliferation, migration and contractility in ovine foetal pulmonary arterial smooth muscle cells. Cell Prolif. 2012 Aug;45(4):335-44.