

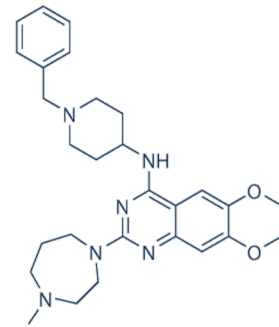
## BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1123-10mM	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1123-5mg	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1123-25mg	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-(1-benzylpiperidin-4-yl)-6,7-dimethoxy-2-(4-methyl-1,4-diazepan-1-yl)quinazolin-4-amine; trihydrochloride
简称	BIX01294
别名	BIX 01294, BIX-01294
中文名	N/A
化学式	C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> ·3HCl
分子量	600.02
CAS号	1392399-03-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 98mg/ml; DMSO 98mg/ml; Ethanol 8mg/ml
溶液配制	5mg加入0.83ml DMSO, 或每6.00mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1123-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	BIX01294是一种G9a histone methyltransferase抑制剂, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为2.7μM, 降低大部分组蛋白H3K9me <sub>2</sub> , 也微弱抑制GLP(主要是H3K9me <sub>3</sub> ), 对其他组蛋白甲基转移酶没有显著的抑制活性。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	G9a	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	2.7μM	—	—	—	—
体外研究	BIX01294是选择性的G9a组蛋白甲基转移酶抑制剂, 在实验浓度范围内不影响SUV39H1(H320R)和PRMT1。BIX-01294特异性抑制G9a (H3K9me <sub>2</sub> ), 并在较小程度上抑制密切相关的GLP酶(主要是H3K9me <sub>3</sub> ), 作用于G9a和GLP, IC <sub>50</sub> 分别为1.7μM和38μM。BIX-01294抑制G9a, 与SAM按非竞争性的方式。BIX-01294(4.1μM)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H3K9me <sub>2</sub> 水平。BIX-01294是抑制有价值的染色体H3K9me <sub>2</sub> 瞬态调制的抑制剂。BIX-01294在一些G9a靶向基因上, 包括Bim1和Serac1, 降低H3K9me <sub>2</sub> 。BIX01294可使HIV-1病毒从潜伏感染的细胞, 如ACH-2和OM10.1中重新表达。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	在涂有Neutravidin的白色不透明384孔板中进行解离增强镧系荧光免疫分析(DELFLIA)。实验化合物在含4% DMSO的12μg/ml 50mM Tris-HCl pH 8.5中稀释, 每孔分配10μl。空白和对照孔只有化合物缓冲液。10μg/ml GST-G9a和40μM SAM在50mM Tris HCl pH 8.5/10mM DTT中稀释, 然后加入20μl。空白孔只有Tris/DTT缓冲液。加入溶于50mM Tris pH 8.5, 体积为10μl的800nM H3(1-20)-cysbiotin底物, 开始反应, 在室温下温育60分钟。使用100μl洗涤缓冲液洗涤实验板3次。然后实验板的每孔中加入含5ng α-2X-二甲基-H3-K9和5ng山羊抗兔Eu整合物的50μl荧光免疫(FI)缓冲液, 在室温下再温育1小时。使用100μl洗涤缓冲液洗涤实验板3次, 每孔加入50μl增强液。45分钟后在Viewlux微孔板成像仪成像15秒, 测量时间分辨荧光。

细胞实验

细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

- 1.Kubicek S, et al. Mol Cell, 2007, 25(3), 473-481.
- 2.Imai K, et al. J Biol Chem, 2010, 285(22), 16538-16545.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD1123-10mM	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1123-5mg	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1123-25mg	BIX01294 (Histone Methyltransferase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01