

I-BET151

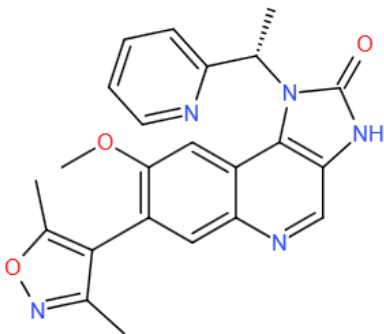
产品简介

I-BET151 (GSK1210151A; IBET151)是一种选择性的 BET 抑制剂, 分别抑制 BRD3 ($IC_{50}=0.25 \mu M$)、BRD2 ($IC_{50}=0.5 \mu M$)和 BRD4 ($IC_{50}=0.79 \mu M$), 其对 BRD3/2/4 的 pIC_{50} 值为 6.1-6.6, 能抑制肿瘤细胞增殖, 具有抑癌作用。

产品信息

货号	54072ES08 / 54072ES10
规格	5 mg / 10 mg

产品性质

英文别名 (English Synonym)	IBET151; I BET151; GSK1210151A; GSK-1210151A; GSK 1210151A
靶点 (Target)	BRD3; BRD2; BRD4
通路 (Pathway)	Epigenetics--Epigenetic Reader Domain
CAS 号 (CAS NO.)	1300031-49-5
分子式 (Formula)	$C_{23}H_{21}N_5O_3$
分子量 (Molecular Weight)	415.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	易溶于 DMSO 和乙醇
结构式 (Structure)	

储存条件

-25~-15°C保存, 有效期 3 年。

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. 避光干燥保存, 避免反复冻融。
4. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
5. 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）

I-BET151 对 BRD2、BRD3 和 BRD4 具有高亲和力， K_d 为 0.02-0.1 μM 。I-BET151 显著诱导细胞凋亡和细胞 G0/G1 期停滞，通过诱导早期细胞周期停滞和细胞凋亡，对人和鼠 MLL 融合白血病细胞系具有深远的疗效。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

I-BET151 (30 mg/kg; 腹腔注射) 处理携带 MLL-AF9 细胞的 C57BL/6 小鼠，结果显示在携带 MLL-AF9 细胞的 C57BL/6 小鼠中，I-BET151 显著促进小鼠存活，抑制小鼠 MLL-AF9 细胞肿瘤生长，延长小鼠寿命。^[1]

参考文献

[1] Dawson MA, et al. Inhibition of BET recruitment to chromatin as an effective treatment for MLL-fusion leukaemia. Nature. 2011 Oct 2;478(7370):529-33.