

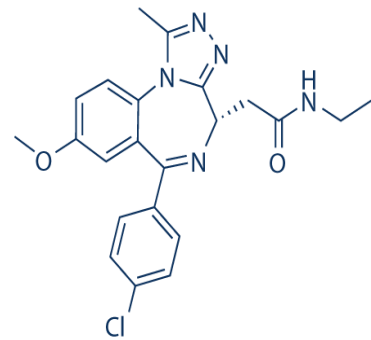
## I-BET-762 (GSK525762) (BET抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0069-10mM	I-BET-762 (GSK525762) (BET 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0069-5mg	I-BET-762 (GSK525762) (BET 抑制剂)	5mg
SC0069-25mg	I-BET-762 (GSK525762) (BET 抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[(4S)-6-(4-chlorophenyl)-8-methoxy-1-methyl-4H-[1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]benzodiazepin-4-yl]-N-ethylacetamide
简称	I-BET-762
别名	GSK525762, GSK525762A, GSK-525762A, GSK 525762A, I-BET 762
中文名	N/A
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>
分子量	423.9
CAS号	1260907-17-2
纯度	99.9%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 84mg/ml; Ethanol 42mg/ml warmed
溶液配制	5mg加入1.18ml DMSO, 或者每4.24mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0069-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	I-BET-762是一种BET蛋白抑制剂, 无细胞试验中IC50约为35nM, 抑制巨噬细胞产生促炎性蛋白质, 并抑制急性炎症, 对其他溴区结合域包含的蛋白具有高度选择性。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	BET proteins	—	—	—	—
IC50	35nM	—	—	—	—
体外研究	I-BET-762抑制BET(溴区和额外的末端结构域) 蛋白、BRD2、BRD3和BRD4, 结合到BET的串联溴区, Kd为50.5-61.3nM, 在FRET分析中, 置换BET串联溴区的一种四乙酰化的H4肽, IC50为32.5-42.5nM。I-BET-762占据BET蛋白的乙酰基-赖氨酸结合口袋, 并抑制BET蛋白结合到乙酰化的组蛋白, 从而破坏了炎症基因表达必不可少的染色质复合物的形成。分化过程中的第2天使用I-BET-762处理, 改变CD4 <sup>+</sup> T细胞的细胞因子产生, 上调一些抗炎基因产物的表达, 并下调一些促炎细胞因子的表达。				
体内研究	I-BET-762保护防止脂多糖诱导的内毒素休克和细菌诱导的脓毒症。LPS注射后1.5小时, 单剂量I-BET处理, 可治愈小鼠。I-BET每日两次注射, 持续2天, 保护小鼠免于脓毒症引起的死亡。早期I-BET-762处理实验性自身免疫性脑脊髓炎(EAE)小鼠模型, 抑制Th1分化的2D2 T细胞诱发神经性炎症的能力。				
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	在有四乙酰化的组蛋白H4肽(200nM)存在时, 在50mM HEPES pH7.5、50mM NaCl、0.5mM CHAPS中进行对BRD2(200nM)、BRD3(100nM)和BRD4(50nM)的I-BET滴定。平衡1小时后, 在含0.05%(v/v)BSA和400mM KF的实验缓冲液中加入2nM钬穴状化合物标记的链霉亲和素和10nM XL-665标记的anti-6His抗体, 使用FRET检测溴区蛋白: 肽相互作用。使用Envision酶标仪(激发波长320nm, 发射波长615nm和665nm)对实验板进行读数。

细胞实验	
细胞系	CD4 <sup>+</sup> T细胞

浓度	~500nM
处理时间	60-72小时
方法	从10到12周的小鼠淋巴结和脾中分离CD4 <sup>+</sup> T细胞，在指定细胞因子存在时，使用与板结合的anti-CD3和anti-CD28抗体活化。在最初激活的60-72小时，包含I-BET-762化合物。在T细胞培养和扩张的5天过程中，化合物稀释到初始浓度的12倍。

动物实验	
动物模型	小鼠
配制	20% β-环糊精、2% DMSO溶于0.9%生理盐水
剂量	30mg/kg
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

1. Nicodeme E, et al. Nature. 2010; 468(7327):1119-1123.
2. Bandukwala HS, et al. PNAS. 2012; 109(36):14532-14537.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC0069-10mM	I-BET-762 (GSK525762) (BET抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0069-5mg	I-BET-762 (GSK525762) (BET抑制剂)	5mg
SC0069-25mg	I-BET-762 (GSK525762) (BET抑制剂)	5mg×5
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

**注意事项:**

- 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降于管底后再开盖使用。
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、体内研究结果或其它相关文献，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的等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2021.07.27