



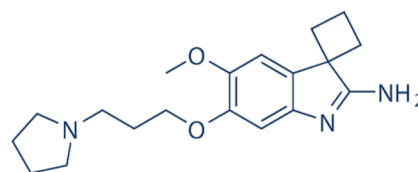
A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1092-10mM	A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1092-5mg	A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1092-25mg	A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(3aR)-2-(2-hydroxyphenyl)-3a-methyl-1-[3-(trifluoromethyl)benzoyl]-3,4,6,6a-tetrahydro-2H-pyrrolo[2,3-b]pyrrol-5-one
简称	A-366
别名	MS-2629, HMS2312E03, AKOS005107865, SMR000126755
中文名	N/A
化学式	C ₁₉ H ₂₇ N ₃ O ₂
分子量	329.44
CAS号	1527503-11-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 65mg/ml; Ethanol 65mg/ml
溶液配制	5mg加入1.52ml DMSO, 或每3.29mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1092-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	A-366 is a potent and selective G9a/GLP histone lysine methyltransferase inhibitor with IC50 of 3.3nM, exhibiting >1000-fold selectivity for G9a/GLP over 21 other methyltransferases.				
信号通路	Epigenetics				
靶点	G9a/GLP	—	—	—	—
IC50	3.3nM	—	—	—	—
体外研究	A-366 has significantly less cytotoxic effects on the growth of tumor cell lines compared to other known G9a/GLP small molecule inhibitors despite equivalent cellular activity on methylation of H3K9me2. Treatment of various leukemia cell lines in vitro results in marked differentiation and morphological changes of these tumor cell lines.				
体内研究	Treatment of a flank xenograft leukemia model with A-366 results in growth inhibition consistent with the profile of H3K9me2 reduction observed.				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	PC-3 prostate adenocarcinoma cells
浓度	0, 0.01, 0.03, 0.1, 0.3, 1, 3, 10μM
处理时间	72h
方法	PC-3 prostate adenocarcinoma cells are incubated in triplicate with DMSO or the indicated concentrations of A-366 or UNC0638 for 72 hours. H3K9me2 levels are assessed by In-Cell Western assay.

动物实验	
------	--

动物模型	SCID-beige female mice (Aml flank xenograft model)
配制	98% PEG-400 and 2% Tween-80
剂量	30mg/kg/day
给药方式	by osmotic mini-pump

➤ **参考文献:**

- 1.Pappano WN, et al. PLoS One. 2015, 10(7):e0131716.
- 2.Sweis RF, et al. ACS Med Chem Lett. 2014, 5(2):205-209.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1092-10mM	A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1092-5mg	A-366 (Histone Methyltransferase抑制剂)	5mg
SD1092-25mg	A-366 (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