

产品名称：EPZ015866
产品别名：GSK591

生物活性:

Description	GSK591 (EPZ015866) is a potent and selective inhibitor of protein methyltransferase 5 (PRMT5) with an IC50 of 4 nM[1].				
IC ₅₀ & Target	IC50: 4 nM (PRMT5)[1]				
In Vitro	GSK591 (5 μM; MCF7, T47D, and MCF10A cells) treatment suppresses breast cancer stem cells (BCSCs) proliferation and self-renewal. GSK591 reduces BCSCs numbers in vitro[2].				
	Cell Proliferation Assay[2]				
	Cell Line:	MCF7, T47D, and MCF10A cells			
	Concentration:	5 μM			
	Incubation Time:				
	Result:	Suppressed BCSCs proliferation and self-renewal.			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 135 mg/mL (354.81 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.6283 mL	13.1413 mL	26.2826 mL
		5 mM	0.5257 mL	2.6283 mL	5.2565 mL
		10 mM	0.2628 mL	1.3141 mL	2.6283 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。				
	In Vivo: 请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶				
	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。				
	2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。				

	<p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.91 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。</p>
References	<p>[1]. [1] Kenneth W. Duncan et al. Structure and Property Guided Design in the Identification of PRMT5 Tool Compound EPZ015666. ACS Med. Chem. Lett., 2016, 7 (2), pp 162-166.</p> <p>[2]. Chiang K, et al. PRMT5 Is a Critical Regulator of Breast Cancer Stem Cell Function via Histone Methylation and FOXP1 Expression. Cell Rep. 2017 Dec 19;21(12):3498-3513.</p>



源叶生物