

产品说明

GSK126 产品说明书

1. 产品概述与化学特性

GSK126 是一种高选择性小分子抑制剂，化学名称为 1-[(2S)-butan-2-yl]-N-[(4,6-dimethyl-2-oxo-1H-pyridin-3-yl)methyl]-3-methyl-6-(6-piperazin-1-yl)pyridin-3-yl)indole-4-carboxamide，分子式为 C₃₁H₃₈N₆O₂，分子量 526.672。该化合物为白色至类白色结晶粉末，CAS 号为 1346574-57-9，纯度经 HPLC 验证大于 96%。其结构特征包含吲哚骨架和哌嗪基团，具有优异的溶解性和稳定性，适合体外及体内研究。

2. 生物化学功能与重要性

GSK126 是 EZH2 (zeste 基因增强子同源物 2) 甲基转移酶的高效选择性抑制剂，通过竞争性结合 EZH2 的 S-腺苷甲硫氨酸结合位点，抑制组蛋白 H3K27 的三甲基化 (H3K27me₃)。这一机制在表观遗传调控中至关重要，尤其在肿瘤发生、免疫调节及干细胞分化等领域具有广泛研究价值。其 IC₅₀ 值低于 10 nM，对 EZH2 的选择性显著高于其他甲基转移酶。

3. 主要应用领域与具体用途

GSK126 广泛应用于癌症研究和表观遗传学领域，具体包括：

- (1) 作为工具化合物，用于探究 EZH2 在淋巴瘤、乳腺癌等恶性肿瘤中的作用机制；
- (2) 体外细胞实验和动物模型中验证 EZH2 抑制剂的抗肿瘤效果；
- (3) 联合用药研究，探索与化疗或免疫疗法的协同效应；
- (4) 表观遗传重编程及干细胞分化研究。

4. 储存条件与使用建议

本品需避光保存于 -20° C 干燥环境中，长期储存建议置于惰性气体保护下。使用时需恢复至室温并短暂离心以避免结块。推荐溶解于 DMSO (浓度 ≤ 10 mM) 或 PBS

缓冲液（含 0.1% Tween-80），现配现用。避免反复冻融，分装后未使用的溶液应丢弃。

5. 质量控制与安全信息

本产品经质谱（MS）和核磁共振（NMR）验证结构，HPLC 检测纯度 $\geq 96\%$ 。使用时需穿戴防护装备（手套、护目镜及实验服），避免吸入或接触皮肤。如不慎接触，立即用大量清水冲洗并就医。废弃物需按危险化学品规范处置。本品仅限科研用途，严禁用于人体或临床治疗。

（注：以上信息基于现有研究数据，具体实验条件需根据实际需求优化。）