

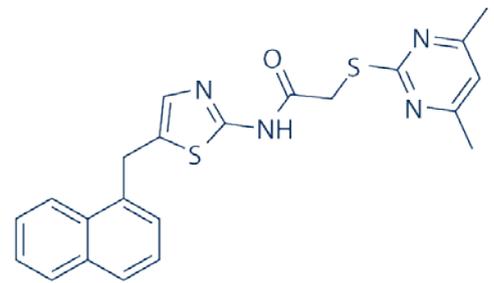
SirReal2 (SIRT2抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|------------|
| SC0290-10mM | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC0290-5mg | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 5mg |
| SC0290-25mg | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 化学名 | 2-(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)sulfanyl-N-[5-(naphthalen-1-ylmethyl)-1,3-thiazol-2-yl]acetamide |
| 简称 | SirReal2 |
| 别名 | SirReal 2; 3TE; BAS 09687905; AC1LM3MJ; ZINC818861; STL019057; ZINC00818861; ST50111553 |
| 中文名 | — |
| 化学式 | C ₂₂ H ₂₀ N ₄ OS ₂ |
| 分子量 | 420.55 |
| CAS号 | 709002-46-0 |
| 纯度 | 98.7% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 84mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入1.19ml DMSO, 或每4.21mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0290-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------------------|------------------------------------------------------------------------|---|---|---|---|
| 产品描述 | SirReal2是一种有效的选择性Sirt2抑制剂, IC ₅₀ 为140nM。 | | | | |
| 信号通路 | Epigenetics; DNA Damage | | | | |
| 靶点 | SIRT2 | — | — | — | — |
| IC ₅₀ | 140nM | — | — | — | — |
| 体外研究 | 在HeLa细胞中, SirReal2通过Sirt2-特异性氨基酸网络选择性抑制Sirt2, 并诱导微管蛋白高度乙酰化和BubR1的显著消耗。 | | | | |
| 体内研究 | 在体内, SirReal2抑制Sirt2活性, 而不影响其他I类抗衰老酶Sirt1和Sirt3的活性。 | | | | |
| 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 | <p>初始筛选通过高通量荧光试验使用合成的基底ZMAL (Z-Lys(Acetyl)-AMC)进行。人Sirt1133-747, 人Sirt225-389, 人Sirt3101-399或Sirt3118-395与试验缓冲液(50mM Tris/HCl, 137mM NaCl, 2.7mM KCl, 1mM MgCl₂ pH 8.0), β-NAD⁺ (终试验浓度500μM), 底物ZMAL (12.6mM储备液在DMSO中稀释到终试验浓度10.5μM), 以及DMSO中不同浓度的各抑制剂混合, DMSO作为对照组(终DMSO浓度5-20%(v/v))。混合物在37°C下, 以150r.p.m搅拌培育4小时。加入包含NCA和胰蛋白酶(50mM Tris/HCl, 100mM NaCl, 6.7%(v/v)DMSO, 胰蛋白酶5.5U/μl, 8mM NCA pH8.0, 60μl)的溶液停止脱乙酰化, 然后培育混合物使脱乙酰化产物胰蛋白酶化以释放荧光(20min, 37°C, 150r.p.m.)。随后荧光强度在酶标仪(λ_{ex} 390nm, λ_{em} 460nm)上测量。混合物中抑制的量与DMSO对照组进行确定。IC₅₀值通过Graphpad Prism软件使用非线性回归拟合剂量响应曲线来确定。SirReal1和SirReal2与非标记的乙酰-赖氨酸多肽底物(基于α-微管蛋白与两个另外的色氨酸(残基36-44, H-PSDK(Acetyl)TIGGWW-NH₂, 10μM)) 进行Sirt1-3抑制测试。SirReal2与非标记乙酰-赖氨酸多肽底物(Sirt5: Benzoyl-GVLK(Succinyl)EYGV-NH₂, 10μM; Sirt6: Ac-EALPKK(Myristoyl)TGG-NH₂, 10μM)进行Sirt5-6抑制测试。底物进行培育(10min, ~0.5μM</p> |

| | |
|--|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| | Sirt1/2/3/5/6, 500 μ M β -NAD ⁺ , 5-20%(v/v)DMSO, 50mM Tris/HCl, 137mM NaCl, 2.7mM KCl, 1mM MgCl ₂ pH8.0), 通过加入三氟乙酸(TFA, 10%(v/v), 终浓度1%(v/v))停止。终止反应混合物的成分通过HPLC(Agilent 1100, Phenomenex反相柱Kinetex RP18 2.7 μ M, 50 \times 3mm)使用线性梯度的乙腈(20-60%(v/v)乙腈, 0.1%(v/v)TFA, 0.6ml/min)进行分离。乙酰化的和脱乙酰化的底物通过280nm下的吸光度定量。Sirt4-依赖性脱乙酰化反应与乙酰化Nnt397-多肽(H-NITKLLK(Acetyl)AISPDK-NH ₂ , 250 μ M, GL BioChem, 在50mM Tris/HCl中, 150mM NaCl pH7.5)进行。在0和45分钟之间取样, 反应通过以1:1与0.5%(v/v)TFA混合停止。随后将样品用0.1%(v/v)甲酸稀释到5 μ M的多肽浓度, 并自连接到LTQ质谱仪的EASY-nLCII上分析。多肽在reprosil C18反相柱上通过线性梯度的乙腈(0-100%(v/v), 0.1%(v/v)TFA, 300nl/min)分离。乙酰化和脱乙酰化多肽的峰面积使用Skyline55提取。DMSO溶液用作阴性对照, 而生理抑制剂NCA溶液作为阳性对照。 |
|--|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

| 细胞实验 | |
|------|-----|
| 细胞系 | N/A |
| 浓度 | N/A |
| 处理时间 | N/A |
| 方法 | N/A |

| 动物实验 | |
|------|-----|
| 动物模型 | N/A |
| 配制 | N/A |
| 剂量 | N/A |
| 给药方式 | N/A |

参考文献:

1. Rumpf T, et al. Nat Commun. 2015; 6:6263.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|---------------------|
| SC0290-10mM | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 10mM \times 0.2ml |
| SC0290-5mg | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 5mg |
| SC0290-25mg | SirReal2 (SIRT2抑制剂) | 25mg |
| — | 说明书 | 1份 |

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月有效。

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成高浓度的储备液(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 2017.02.09