



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **OSS-128167**

CAS 号: **887686-02-4**

产品货号: **S88735**

生物活性:					
Description	OSS_128167 是一种有效的选择性沉默调节蛋白 6 (SIRT6) 抑制剂, 对 SIRT6, SIRT1 和 SIRT2 的 IC50 分别为 89 μM, 1578 μM 和 751 μM。OSS_128167 具有抗 HBV 活性, 可抑制 HBV 的转录和复制。OSS_128167 具有抗癌, 抗炎和抗病毒作用。				
IC50 & Target[1][2]	SIRT6 89 μM (IC50)	SIRT2 751 μM (IC50)	SIRT1 1578 μM (IC50)	HBV	
In Vitro	OSS_128167 (化合物 9; 100 μM; 0-24 小时; BxPC3 细胞) 处理增加 H3K9 乙酰化。并且还增加了 BxPC-3 细胞中的 GLUT-1 表达[1]。				
	OSS_128167 (化合物 9) 有效地减弱了培养的 BxPC 中佛波醇肉豆蔻酸酯乙酸酯 (PMA) 诱导的 TNF-α 分泌-3 个细胞。OSS_128167 增加细胞对葡萄糖的摄取[1]。				
	OSS_128167 (100 μM; 96 小时; HepG2.2.15 和 HepG2-NTCP 细胞) 处理显著降低 HBV 核心 DNA 和 3.5-Kb RNA 水平。OSS_128167 处理还抑制乙型肝炎表面抗原 (HBsAg) 和乙型肝炎包膜抗原 (HBeAg) 分泌, 以及细胞裂解物中的 HBsAg 表达[2]。				
	OSS_128167 (200 μM) 诱导原发性多发性骨髓瘤 (MM) 细胞 (NCI-H929) 以及马法兰耐药 (LR-5) 和阿霉素耐药 (Dox40) MM 细胞系的化学增敏[3]。				
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	BxPC3 cells			
	Concentration:	100 μM			
	Incubation Time:	0 hours, 2 hours, 6 hours, 18 hours, 24 hours			
	Result:	Increased H3K9 acetylation.			
	RT-PCR[2]				
In Vivo	Cell Line:	HepG2.2.15 and HepG2-sodium taurocholate cotransporting polypeptide (NTCP) cells			
	Concentration:	100 μM			
	Incubation Time:	96 hours			
	Result:	Significantly decreased HBV core DNA and 3.5-Kb RNA levels.			
	OSS_128167 (50 mg/kg; 腹腔注射; 每 4 天一次; 持续 12 天; 雄性 HBV 转基因小鼠) 处理显著抑制 HBV 转基因小鼠的 HBV DNA 和 3.5-Kb RNA 水平[2]。				
In Vivo	Animal Model:	Male HBV transgenic mice (6-8-week-old)[2]			
	Dosage:	50 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; every 4 days; for 12 days			
	Result:	The level of HBV DNA and 3.5-Kb RNA were markedly suppressed in HBV transgenic mice.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (272.99 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
Solvent&Solubility	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass		
		Concentration			
		1 mg			
		5 mg			
Solvent&Solubility	Preparing Stock Solutions	1 mM	2.7299 mL	13.6493 mL	27.2985 mL
		5 mM	0.5460 mL	2.7299 mL	5.4597 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

	10 mM	0.2730 mL	1.3649 mL	2.7299 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°C, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时，请在 1 年内使用， -20°C 储存时，请在 6 个月内使用。 动物实验： 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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.68 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.68 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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。 方案 一 请依序添加每种溶剂： 0.5% CMC-Na/saline water Solubility: 10 mg/mL (27.30 mM); 悬浊液; 超声助溶	*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°C, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时，请在 1 年内使用， -20°C 储存时，请在 6 个月内使用。				
	参考文献	[1]. Parenti MD, et al. Discovery of novel and selective SIRT6 inhibitors. J Med Chem. 2014 Jun 12;57(11):4796-804. [2]. Jiang H, et al. SIRT6 Inhibitor, OSS_128167 Restricts Hepatitis B Virus Transcription and Replication Through Targeting Transcription Factor Peroxisome Proliferator-Activated Receptors α. Front Pharmacol. 2019 Oct 25;10:1270. [3]. Cea M, et al. Evidence for a role of the histone deacetylase SIRT6 in DNA damage response of multiple myeloma cells. Blood. 2016 Mar 3;127(9):1138-50.			
	完整储备液配制表：	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° C, 1 year; -20° C, 6 months。-80° C 储存时，请在 1 年内使用， -20° C 储存时，请在 6 个月			



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	浓度				
DMSO	1 mM	2.7299 mL	13.6493 mL	27.2985 mL	68.2463 mL
	5 mM	0.5460 mL	2.7299 mL	5.4597 mL	13.6493 mL
	10 mM	0.2730 mL	1.3649 mL	2.7299 mL	6.8246 mL
	15 mM	0.1820 mL	0.9100 mL	1.8199 mL	4.5498 mL
	20 mM	0.1365 mL	0.6825 mL	1.3649 mL	3.4123 mL
	25 mM	0.1092 mL	0.5460 mL	1.0919 mL	2.7299 mL
	30 mM	0.0910 mL	0.4550 mL	0.9100 mL	2.2749 mL
	40 mM	0.0682 mL	0.3412 mL	0.6825 mL	1.7062 mL
	50 mM	0.0546 mL	0.2730 mL	0.5460 mL	1.3649 mL
	60 mM	0.0455 mL	0.2275 mL	0.4550 mL	1.1374 mL
	80 mM	0.0341 mL	0.1706 mL	0.3412 mL	0.8531 mL
	100 mM	0.0273 mL	0.1365 mL	0.2730 mL	0.6825 mL

源叶