



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: **SirReal 2**
CAS 号: **709002-46-0**
产品货号: **S89188**

生物活性:

Description	SirReal2 是一种强效的, 选择性抑制 Sirt2 的抑制剂, IC50 值为 140 nM, 对 Sirt3-5 的活性影响很小。SirReal2 在 HeLa 细胞中引起微管过乙酰化, 并导致检查点蛋白 BubR1 的不稳定。SirReal2 与 VS-5584 结合可抑制肿瘤生长, 并延长肿瘤异种移植模型小鼠的生存率。SirReal2 有望用于癌症, 炎症和神经退行性疾病的研究。					
IC50 & Target[1]	SIRT2 140 nM (IC50)					
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description		
	K562	IC50	> 100 μM	Cytotoxicity against human K562 cells assessed as reduction in cell viability measured after 1 day by MTT assay		
	MCF7	IC50	13.7 μM	Cytotoxicity against human MCF7 cells assessed as reduction in cell viability measured after 4 days by MTT assay		
	MT2	IC50	> 100 μM	Cytotoxicity against human MT2 cells assessed as reduction in cell viability measured after 1 day by MTT assay		
In Vitro	SirReal2 (1 μM, 24 小时)与 VS-5584 (1 μM, 24 小时) 联合使用能够抑制急性髓系白血病细胞增殖, 增加凋亡细胞的比例并诱导细胞周期停滞[3]。					
In Vivo	SirReal2 (4 mg/kg, 腹腔注射, 每 3 天一次, 持续 28 天) 与 VS-5584 (4mg/kg, 腹腔注射, 每 3 天一次, 持续 28 天) 联合使用, 可延长小鼠的生存时间, 并表现出显著的抗肿瘤效果[3]。					
	SirReal2 (50 mg/kg, 腹腔注射, 每 3 天一次, 持续 19 天) 抑制小鼠中 SIRT2 的表达, 恢复 NK 细胞对肿瘤的浸润, 抑制黑色素瘤的进展[4]。					
	Animal Model:		mouse tumor xenograft model[3]			
	Dosage:		4 mg/kg			
	Administration:		i.p., every 3 days for 28 days			
Result:		Restrained the growth of subcutaneous xenografts combined with VS-5584 in vivo.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 31.25 mg/mL (74.31 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)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM		2.3778 mL	11.8892 mL	23.7784 mL
		5 mM		0.4756 mL	2.3778 mL	4.7557 mL
10 mM			0.2378 mL	1.1889 mL	2.3778 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 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 (4.95 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.95 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 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.95 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。
参考文献	[1]. Rumpf T, et al. Selective Sirt2 inhibition by ligand-induced rearrangement of the active site. Nat Commun. 2015 Feb 12;6:6263. [2]. Schiedel M, et al. Structure-Based Development of an Affinity Probe for Sirtuin 2. Angew Chem Int Ed Engl. 2016;55(6):2252-2256. [3]. Luo Y, et al. SIRT2 inhibitor SirReal2 enhances anti-tumor effects of PI3K/mTOR inhibitor VS-5584 on acute myeloid leukemia cells. Cancer Med. 2023 Sep;12(18):18901-18917. [4]. Zhang M, et al. SIRT2 promotes murine melanoma progression through natural killer cell inhibition. Sci Rep. 2021 Jun 21;11(1):12988.
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, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3778 mL	11.8892 mL	23.7784 mL	59.4460 mL
	5 mM	0.4756 mL	2.3778 mL	4.7557 mL	11.8892 mL
	10 mM	0.2378 mL	1.1889 mL	2.3778 mL	5.9446 mL
	15 mM	0.1585 mL	0.7926 mL	1.5852 mL	3.9631 mL
	20 mM	0.1189 mL	0.5945 mL	1.1889 mL	2.9723 mL
	25 mM	0.0951 mL	0.4756 mL	0.9511 mL	2.3778 mL
	30 mM	0.0793 mL	0.3963 mL	0.7926 mL	1.9815 mL
	40 mM	0.0594 mL	0.2972 mL	0.5945 mL	1.4861 mL
	50 mM	0.0476 mL	0.2378 mL	0.4756 mL	1.1889 mL
	60 mM	0.0396 mL	0.1982 mL	0.3963 mL	0.9908 mL

