



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: **AZ505**
CAS 号: **1035227-43-0**
产品货号: **S89227**

生物活性:

Description	AZ505 是一种有效的, 具有选择性的 SMYD2 抑制剂, IC50 值为 0.12 μM。				
IC50 & Target	SMYD2				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	MDA-MB-231	IC50	13.1 μM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CellTiter-Glo luminescent cell viability assay	
	MDA-MB-231	IC50	2900 nM	Inhibition of N-terminal 2xc-myc-tagged human SMYD2 transfected in human MDA-MB-231 cells assessed as reduction in AHNAK methylation after 72 hrs by ICW assay	
	U2OS	IC50	< 10000 nM	Inhibition of SMYD2 (unknown origin) expressed in human U2OS cells assessed as reduction in p53 methylation by Western blot analysis	
In Vitro	AZ505 具有高选择性, 并在体外显示亚微摩尔浓度的活性。AZ505 对 SMYD2 的 IC50 为 0.12 μM, 比 AZ505 对其他组蛋白甲基转移酶, 如 SMYD3 (IC50>83.3 μM)、DOT1L (IC50>83.3 μM) 和 EZH2 (IC50>83.3 μM)[1]。AZ505 是一种有效的选择性 SMYD2 抑制剂, IC50 为 0.12 μM。蛋白质赖氨酸甲基转移酶的人类 SMYD (含 SET 和 MYND 结构域的蛋白质) 家族包含五个成员 (SMYD1-5)。此外, AZ505 无法抑制一组蛋白质赖氨酸甲基转移酶的酶活性。AZ505 被提名用于 ITC 结合研究, Kd 为 0.5 μM。相比之下, p53 底物肽的计算 Kd 为 3.7 μM。AZ505 与 SMYD2 的结合主要由熵驱动, 这通常表明结合是由与少数特定氢键的疏水相互作用介导的[2]				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 135 mg/mL (233.75 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.7315 mL	8.6574 mL	17.3148 mL
		5 mM	0.3463 mL	1.7315 mL	3.4630 mL
		10 mM	0.1731 mL	0.8657 mL	1.7315 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: 6.25 mg/mL (10.82 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 6.25 mg/mL 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 62.5 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: 6.25 mg/mL (10.82 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 6.25 mg/mL 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 62.5 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。 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: 6.25 mg/mL (10.82 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 6.25 mg/mL 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 62.5 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]. Komatsu S, et al. Overexpression of SMYD2 contributes to malignant outcome in gastric cancer. Br J Cancer. 2015 Jan 20;112(2):357-64. [2]. Ferguson AD, et al. Structural basis of substrate methylation and inhibition of SMYD2. Structure. 2011 Sep 7;19(9):1262-73. [3]. Li LX, et al. Lysine methyltransferase SMYD2 promotes cyst growth in autosomal dominant polycystic kidney disease. J Clin Invest. 2017 Jun 30;127(7):2751-2764.

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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.7315 mL	8.6574 mL	17.3148 mL	43.2870 mL
	5 mM	0.3463 mL	1.7315 mL	3.4630 mL	8.6574 mL
	10 mM	0.1731 mL	0.8657 mL	1.7315 mL	4.3287 mL
	15 mM	0.1154 mL	0.5772 mL	1.1543 mL	2.8858 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: shyyssw@sina.com

	20 mM	0.0866 mL	0.4329 mL	0.8657 mL	2.1644 mL
	25 mM	0.0693 mL	0.3463 mL	0.6926 mL	1.7315 mL
	30 mM	0.0577 mL	0.2886 mL	0.5772 mL	1.4429 mL
	40 mM	0.0433 mL	0.2164 mL	0.4329 mL	1.0822 mL
	50 mM	0.0346 mL	0.1731 mL	0.3463 mL	0.8657 mL
	60 mM	0.0289 mL	0.1443 mL	0.2886 mL	0.7215 mL
	80 mM	0.0216 mL	0.1082 mL	0.2164 mL	0.5411 mL
	100 mM	0.0173 mL	0.0866 mL	0.1731 mL	0.4329 mL



源叶