

SRT-1720; SRT1720

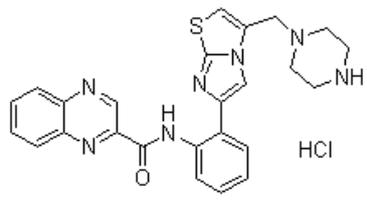
产品编号: MB3760

质量标准: >98%, SIRT1 激活剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: powder

基本信息

分子式	C25H23N7OS.HCl	结 构 式	
分子量	506.02		
CAS No.	1001645-58-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 38 mg/mL (75.09 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: SRT 1720 Hydrochloride 是选择性的 SIRT1 激活剂, 对 SIRT2 和 SIRT3 的作用较弱。

别名: SRT-1720;SRT 1720;SRT 1720 Hydrochloride;

N-[2-[3-(1-Piperazinylmethyl)imidazo[2,1-b]thiazol-6-yl]phenyl]-2-quinolinecarboxamide hydrochloride

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色粉末

溶解性:DMSO: 38 mg/mL (75.09 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	SRT1720 是选择性的 SIRT1 激活剂, EC50 为 0.16 μM,作用于 SIRT2 和 SIRT3 效果低 230 倍以上。
靶点	SIRT1
IC50	0.16 μM (EC1.5)
体外研究	SRT1720 抗最近的乙酰化酶同系物 SIRT2 (EC1.5 为 37 μM)和 SIRT3 (EC1.5 > 300 μM)的最大激活率达 781%。SRT1720 在氨基末端催化区的变构位点结合到 SIRT1 酶-肽底物复合物上, 降低乙酰化底物的米氏常数。用 SRT1720 处理一周后, 饲喂的葡萄糖水平降低, 处理三周后, 饲喂的葡萄糖水平进一步降低, 持续处理 10 周。Rosiglitazone 激活 PPARγ, 已经用于治疗 II 型糖尿病而与 Rosiglitazone 相比, 在进行腹膜葡萄糖耐量试验时, 用 SRT1720 处理导致葡萄糖明显降低。SRT1720 对用无糖食物喂养的鼠没有作用效果, 显示出药理学 SIRT1 的激活不会产生低血糖。与

	Rosiglitazone 相似, 用 SRT1720 处理 4 周, 明显降低高胰岛素血症, 使升高的胰岛素水平恢复部分正常 SRT1720 处理腓肠肌, 通过测定柠檬酸合酶活性发现线粒体各项能力上升 15%。高浓度 SRT1720 (15 μM) 诱导正常细胞活力轻微下降, 约 10-20%。SRT1720 明显抑制 VEGF 依赖的 MM 细胞迁移。
体内研究	在 DIO 鼠中实施摄热量限制包括改善胰岛素敏感性, 使葡萄糖和胰岛素水平维持正常, 及提高线粒体能力后, 可观察到 SRT1720 模拟一些功能。此外, 在饮食导致的肥胖和遗传肥胖鼠中, SRT1720 提高胰岛素敏感性, 降低血浆葡萄糖, 及提高线粒体能力。因此, SRT1720 是有前途的新型治疗剂, 可用于治疗像 II 型糖尿病之类的疾病。与提高的葡萄糖耐量相一致, 在 SRT1720 处理的 fa/fa 鼠中, 维持血糖正常所需的葡萄糖注入率(GIR) 大约为 35%, 全部的葡萄糖处理效率提高大约为 20%。SRT1720 作用于动物肿瘤模型研究时, 抑制多发性骨髓瘤生长。SRT1720 提高 Bortezomib 或 Dexamethasone 的毒性。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3761	EX527 (Selisistat)
MB3762	Sirtinol

用途及描述 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。SRT 1720 Hydrochloride 是选择性的 SIRT1 激活剂, 对 SIRT2 和 SIRT3 的作用较弱。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9762 mL	9.8810 mL	19.7621 mL
5 mM	0.3952 mL	1.9762 mL	3.9524 mL
10 mM	0.1976 mL	0.9881 mL	1.9762 mL
50 mM	0.0395 mL	0.1976 mL	0.3952 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>SIRT1 荧光偏振实验:</p> <p>在 SIRT1 FP 试验中, 使用从 p53 序列中得到的含 20 个氨基酸的肽段 (Ac-Glu-Glu-Lys(biotin)-Gly-Gln-Ser-Thr-Ser-Ser-His-Ser-Lys(Ac)-Nle-Ser-Thr-Glu-Gly-Lys(MR121 或 Tamra)-Glu-Glu-NH₂)。肽段 N 端与生物素相连, C 端用荧光标记修饰。监测酶活的反应是酶活偶联反应, 第一步反应为 SIRT1 催化的脱乙酰反应, 第二步反应为在新暴露的赖氨酸残基处进行胰蛋白酶催化的分裂。为了突出底物和产物的多种区别, 加入链酶亲和素, 反应终止。FP 测试的敏感性可用于鉴定 SRT1720。进行荧光偏振反应环境如下: 0.5 μM 肽底物, 150 μM βNAD⁺, 0-10 nM SIRT1, 25 mM Tris- 醋酸盐 (pH 为 8), 137 mM Na-Ac, 2.7 mM K-Ac, 1 mM Mg-Ac, 0.05% Tween-20, 0.1% Pluronic F127, 10 mM CaCl₂, 5 mM DTT, 0.025% BSA, 及 0.15 mM 烟碱。反应在 37°C 温育, 加入烟碱终止反应, 加入胰蛋白酶分裂脱乙酰底物。加入链酶亲和素在 37°C 温育。在 650 nm 和 680nm 处测定荧光偏振。</p>
细胞实验	Cell lines: 人类血管内皮细胞(HUVECs)

	<p>Concentrations: 5 μM Incubation Time: 2 小时 Method: 使用 Transwell 迁移实验测定迁移率。通过基底膜的毛细血管样管结构形成试剂盒检测体外血管生成。用于内皮血管生成实验, 从 Clonetics 获得的人类血管内皮细胞 (HUVEC), 保存在含 5% FBS 的内皮细胞生长培养基中。使用台盼蓝拒染法测定 HUVEC 细胞活力, 观察到用 SRT1720 处理的细胞死亡率小于 5%。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 MM.1S 细胞的 Chase-SCID 鼠 Formulation: 20% PEG400/0.5% Tween-80/79.5% 去离子水 Dosages: 200 mg/kg Administration: 口服处理</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂 (如 PBS) 稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确保 DMSO 的终浓度 < 5%, 以避免毒性作用。给药剂量设计时候, 可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M ²)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5

小鼠	0.02	0.007	3
----	------	-------	---

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。