

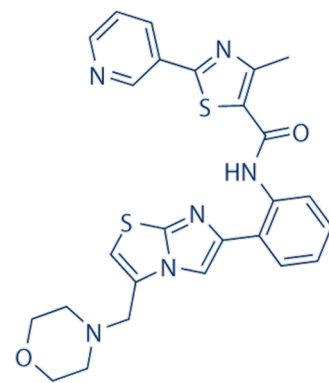
## SRT 2104 (SIRT1激活剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0272-10mM	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	10mM×0.2ml
SC0272-5mg	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	5mg
SC0272-25mg	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-methyl-N-[2-[3-(morpholin-4-ylmethyl)imidazo[2,1-b][1,3]thiazol-6-yl]phenyl]-2-pyridin-3-yl-1,3-thiazole-5-carboxamide
简称	SRT 2104
别名	sirtuin modulator; GSK2245840; SRT2104; HY-15262
中文名	—
化学式	C <sub>26</sub> H <sub>24</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
分子量	516.64
CAS号	1093403-33-8
纯度	99.9%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 16mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.97ml DMSO, 或每5.17mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0272-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	SRT2104 (GSK2245840)是一种选择性SIRT1活化剂, 参与能量平衡的调节。Phase 2。				
信号通路	DNA Damage; Epigenetics				
靶点	SIRT1	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	SRT2104降低C2C12细胞中p65/RelA乙酰化水平。				
体内研究	在雄性C57BL/6J小鼠体内, SRT2104 (100mg/kg, p.o.)延长标准饮食喂养大鼠的平均和最大寿命, 增强运动协调性、骨密度和胰岛素敏感性, 并减少炎症。在萎缩的实验模型中, 短期SRT2104治疗保存骨头和肌肉质量。在雄性N171-82Q HD小鼠体内, SRT2104 (包含0.5% SRT2104的饮食)有效穿透血脑屏障, 减弱脑萎缩, 改善运动功能, 并延长存活时间。				
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	在SIRT1 FP试验中, SIRT1活性使用衍生自p53序列的20个氨基酸多肽(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-NH <sub>2</sub> )监测。多肽N末端连接到生物素, C末端通过荧光标记修饰。监测酶活性的反应是一种偶联酶测定法, 其中第一个反应是SIRT1催化的脱乙酰化反应, 第二个反应是通过胰蛋白酶使新暴露的赖氨酸残基裂解。停止反应, 加入链霉亲和素以突出底物和产物之间的质量差异。荧光偏振反应条件如下: 0.5μM多肽底物、150μM β NAD <sup>+</sup> 、0-10nM SIRT1、25mM Tris-acetate pH8、137mM Na-Ac、2.7mM K-Ac、1mM Mg-Ac、0.05% Tween-20、0.1% Pluronic F127、10mM CaCl <sub>2</sub> 、5mM DTT、0.025% BSA和0.15mM烟酰胺。反应在37°C下培育, 通过加入烟酰胺停止, 加入胰蛋白酶裂解乙酰化的底物。反应在1μM链霉亲和素存在下于37°C培养。荧光偏振在激发光(650nm)和发射光(680nm)波长下测定。

细胞实验	
细胞系	C2C12细胞系

浓度	3 $\mu$ M
处理时间	24h
方法	细胞在低葡萄糖Dulbecco's改良的Eagle's培养基(DMEM)中培养, 用10%牛血清蛋白和青霉素-链霉素增补。细胞用载体(0.1% DMSO)或3 $\mu$ M SRT2104处理24小时, 然后采集, 用于蛋白质免疫印迹法测定。

动物实验	
动物模型	雄性N171-82Q HD小鼠
配制	混在食物中
剂量	包含0.5% SRT2104的饮食
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

- 1.Milne JC, et al. Nature. 2007; 450(7170):712-716.
- 2.Jiang M, et al. Ann Clin Trans Neurol. 2014; 1(12):1047-1052.
- 3.Mercken EM, et al. Aging Cell. 2014; 13(5):787-796.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC0272-10mM	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC0272-5mg	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	5mg
SC0272-25mg	SRT 2104 (SIRT1激活剂)	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:**

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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至管底后再开盖使用。
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, 以及所培养的特定细胞和组织, 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