

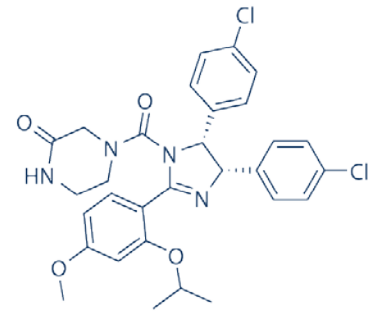
NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4368-10mM	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4368-5mg	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	5mg
SC4368-25mg	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(-)-4-[(4S,5R)-4,5-bis(4-chlorophenyl)-2-(4-methoxy-2-propan-2-yloxyphenyl)-4,5-dihydroimidazole-1-carbonyl]piperazin-2-one
简称	NUTLIN 3A
别名	Nutlin-3A, Nutlin 3a, (-)-Nutlin-3
中文名	N/A
化学式	C ₃₀ H ₃₀ Cl ₂ N ₄ O ₄
分子量	581.49
CAS号	675576-98-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.86ml DMSO, 或每5.81mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4368-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Nutlin-3A是Nutlin-3的活性对映体(异构体), 抑制p53/MDM2相互作用, 无细胞试验中IC50为90nM。Nutlin-3是Nutlin-3A((-)-Nutlin-3)和Nutlin-3B ((+)-Nutlin-3)的混合物, 其中Nutlin-3B的活性比Nutlin-3A的作用效果低150倍, Nutlin-3的活性介于Nutlin-3A和Nutlin-3B之间。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	p53/MDM2 interaction (Cell-free assay)	-	-	-	-
IC50	90nM	-	-	-	-
体外研究	Nutlin-3A从MDM2蛋白的结合口袋置换p53, 由此将p53从抑制和蛋白酶体降解状态释放出来, 从而导致诱导其下游靶点, 细胞周期停滞和细胞凋亡。七天孵育10μM Nutlin-3A导致了NIH3T3细胞的生长抑制达90%以上。Nutlin-3A稳定并激活p53基因, 以剂量依赖性的方式诱导p21的表达。Nutlin-3A有效地减少S期细胞至0.2-2%, 并增加了G1和G2/M期细胞。在40小时后, Nutlin-3A诱导约60% SJS-1和MHM细胞的凋亡, 而到60小时后, 凋亡细胞分别达到85%和65%。				
体内研究	Nutlin-3A以剂量依赖性方式抑制异种移植物生长, 在最高剂量(200毫克/千克)时表现大量的肿瘤收缩。Nutlin-3是p53途径在体内的选择性活化剂, 并高度有效地抗SJS-1骨肉瘤。有野生型p53和MDM2基因扩增的肿瘤对Nutlin-3A治疗应答最好。				
临床实验	N/A				
特征	高度选择性的MDM2抑制剂与对MDMX低得多的效果。对含野生型p53的肿瘤最有效。				

➤ 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	竞争分析是在Biacore S51进行。甲系列S传感器芯片CM5衍生化用于固定一个PentaHis抗体来捕获His-标记的p53。捕获的水平是~200响应单位(1单位响应对应于每毫米21pg的蛋白质)。MDM2蛋白的浓度被保持恒定在300nM。将试验化合物溶解于10mM DMSO中, 并进一步稀释使每个MDM2测试样品中的浓度系列抑制剂。该试验是在25V交流的电泳缓冲液(10mM HEPES, 0.15M的NaCl, 2% DMSO)中运行。MDM2-

p53在抑制剂存在下的结合的计算方法是在没有抑制剂的结合的百分比，IC50是使用微软EXCEL计算。

细胞实验	
细胞系	OSA, T778, RMS13, U2OS, SaOS-2
浓度	~5 μ M
处理时间	120小时
方法	SRB

动物实验	
动物模型	SJSA-1移植体
配制	1% Klucel, 0.1% Tween 80
剂量	50, 100, 200毫克/千克每天两次
给药方式	口服

参考文献:

1. Tovar C, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 2006, 103(6), 1888-1893.
2. Ohnstad HO, et al. BMC Cancer. 2011, 11(211), 1-11.
3. Vassilev LT, et al. Science. 2004, 303(5659), 844-848.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC4368-10mM	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC4368-5mg	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	5mg
SC4368-25mg	NUTLIN 3A (Mdm2抑制剂)	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淀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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其他相关文献，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 2019.03.27