

HB181127

Nutlin-3 (mixture)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Nutlin-3 (mixture)	50801ES08	5mg
Nutlin-3 (mixture)	50801ES25	25mg

产品描述

Nutlin-3 是一种常用的可以通透细胞膜的 MDM2 拮抗剂, 具有很高的选择性, 抑制 MDM2- p53 的相互作用 ($IC_{50}=90$ nM), 并激活 p53。Nutlin-3 通过和 MDM2 结合, 抑制 MDM2 和 p53 的相互作用, 从而激活 p53, 诱导细胞凋亡, 并发挥抗肿瘤作用。

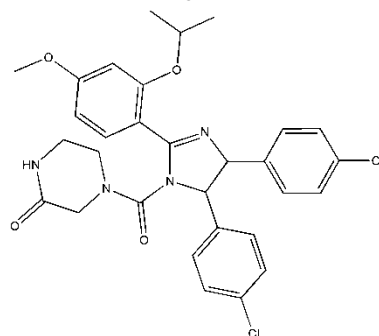
在体外细胞和体内实体瘤移植实验中, Nutlin-3 可作用于功能性 p53 基因, 具有有效的抗肿瘤细胞增殖活性, 但是对突变型的 p53 基因无效。目前, Nutlin-3 已进入临床试验 Phase I 阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Nutlin 3
化学名 (Chemical Name)	(+/-)-4-(4,5-bis(4-chlorophenyl)-2-(2-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-4,5-dihydro-1H-imidazole-1-carbonyl)piperazin-2-one
靶点 (Target)	MDM2/p53
CAS 号 (CAS NO.)	548472-68-0
分子式 (Molecular Formula)	$C_{30}H_{30}Cl_2N_4O_4$
分子量 (Molecular Weight)	581.49
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	>98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO(20mg/ml)和乙醇

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于 -20 °C, 有效期 2 年。易溶于 DMSO。建议分装后 -20 °C 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验

- 1) 利用 Nutlin-3 处理含野生型 p53 的细胞 HCT116, RKO 和 SJSA-1, 诱导 MDM2 和 p21 表达, 结果显示有效的抗增殖活性, IC_{50} 为~1.5 μ M, 但是作用于含突变型 p53 的细胞系 SW480 和 MDA-MB-435 则没有效果。10 μ M Nutlin-3 处理 SJSA-1 细胞 48h, 可显著诱导 Caspase 依赖的细胞凋亡, 凋亡达~45%。^[1]
- 2) 利用 30 μ M Nutlin-3 作用于突变型 p53 的细胞, 结果表明 Nutlin 扰乱内源性 p73-HDM2 相互作用, 且增强 p73 稳定性和促凋亡活性, 导致细胞生长受抑制和诱导凋亡。^[3]

（二）动物实验

按 200 mg/kg 剂量口服 Nutlin-3 处理, 每天两次, 持续 3 周, 结果表明 Nutlin-3 显著抑制 SJAS-1 移植瘤生长, 抑制达 90%, 而 Doxorubicin 抑制 81% 肿瘤生长^[1]。

参考文献

- [1] Vassilev LT, et al. In vivo activation of the p53 pathway by small-molecule antagonists of MDM2.[J]. Science. 303(5659): 844-848 (2004).
- [2] Secchiero P, et al. Recent advances in the therapeutic perspectives of Nutlin-3.[J]. Curr Pharm Des. 17(6): 569-77(2011).
- [3] Lau LM, et al. HDM2 antagonist Nutlin-3 disrupts p73-HDM2 binding and enhances p73 function. Oncogene. 27(7): 997-1003(2008).

HB181127