

Enzalutamide 恩杂鲁胺

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Enzalutamide 恩杂鲁胺	51701ES08	5 mg
	51701ES25	25 mg

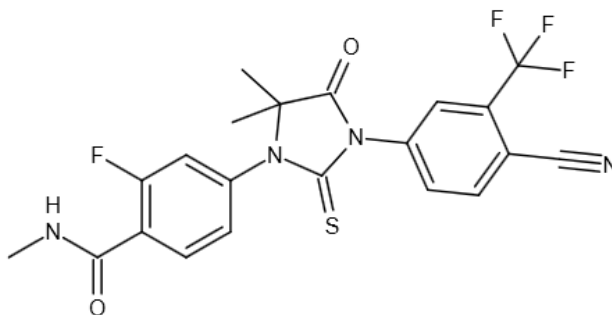
产品描述

Enzalutamide 又称为 MDV3100、MDV-3100，是一种雄性激素受体(Androgen-Receptor, AR)拮抗剂，IC₅₀ 为 36 nM，阻断雄性激素与 AR 结合，阻止核转位和配位受体复合物招募辅激活因子。Enzalutamide 具有口服生物活性，诱导肿瘤细胞凋亡，并诱导小鼠肿瘤衰退，促进细胞自噬，是细胞自噬的激活剂。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	4-[3-[4-cyano-3-(trifluoromethyl)phenyl]-5,5-dimethyl-4-oxo-2-thioxo-1-imidazolidinyl]-2-fluoro-N-methyl-benzamide; MDV3100; MDV 3100; MDV-3100
中文名称 (Chinese Name)	恩杂鲁胺
靶点 (Target)	Androgen-Receptor (AR)
CAS 号 (CAS NO.)	915087-33-1
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₁₆ F ₄ N ₄ O ₂ S
分子量 (Molecular Weight)	464.4
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO，不溶于水

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃，有效期 2 年。建议分装后-20℃避光保存，避免反复冻融。

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

为检测 Enzalutamide 对 AR 靶标基因表达的影响，用 Enzalutamide (0.1-20 μ M)处理 LNCaP 前列腺癌细胞和源自 LNCaP 的雄性激素非依赖的 C4-2 细胞，Enzalutamide 单独作用不会诱导 KLK3 或 TMPRSS2 基因表达；而 Enzalutamide 显著拮抗 DHT 诱导的 PSA 表达。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

体内实验中，给 LNCaP-AR 移植瘤小鼠口服 Enzalutamide (1-50 mg/kg/d)，结果显示 Enzalutamide (10 mg/kg/d)处理能显著抑制肿瘤生长，处理 13 天后，肿瘤体积下降 19%。^[1]

参考文献

- [1]. Guerrero J, et al. Enzalutamide, an androgen receptor signaling inhibitor, induces tumor regression in a mouse model of castration-resistant prostate cancer. *The Prostate*, 73(12): 1291–1305 (2013).
- [2]. Tran C, et al. Development of a second-generation antiandrogen for treatment of advanced prostate cancer. *Science*, 324(5928): 787-790 (2009).
- [3]. Scher HI, et al. Antitumour activity of MDV3100 in castration-resistant prostate cancer: a phase 1-2 study. *Lancet*, 375(9724): 1437-1446 (2010).