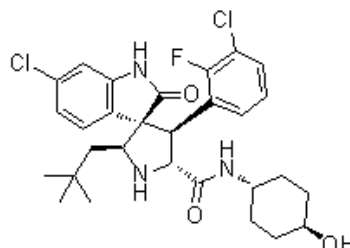


## MI-773 ; SAR405838

产品编号 : MB3605  
质量标准 : >98%,BR  
包装规格 : 5MG;25MG  
产品形式 : powder

### 基本信息

分子式	C29H34Cl2FN3O3	结 构 式	
分子量	562.50		
CAS No.	1303607-60-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (177.77 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 31 mg/mL warmed (55.11 mM)		
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 :** SAR405838 是一种高效的选择性 MDM2 抑制剂, 与 MDM2 结合,  $K_i$  值为 0.88 nM。

**别名 :** MI-77301 ; MI-773 ; SAR405838 ; Spiro[3H-indole-3,3'-pyrrolidine]-5'-carboxamide

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色粉末

溶解性 : .....DMSO :100 mg/mL (177.77 mM) ;Water Insoluble ;Ethanol :31 mg/mL warmed (55.11 mM)

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	MI-773 (SAR405838) 是一种口服生物有效的 MDM2 拮抗剂, $K_i$ 为 0.88 nM。Phase 1。
<b>靶点</b>	p53 MDM2 (Cell-free assay) 0.88 nM( $K_i$ )
<b>体外研究</b>	MI-773 可以和 MDM2 结合 其 $K_i$ 值为 0.88 nm。MI-773 可有效抑制 SJS-1、RS4;11、LNCaP、和 HCT-116 肿瘤细胞的增殖, $IC_{50}$ 值分别为 0.092 $\mu$ M、0.089 $\mu$ M、0.27 $\mu$ M 和 0.20 $\mu$ M。MI-773 对 p53 突变或敲除的肿瘤细胞系表现出高选择性, 包括 SAOS-2、PC-3、SW620 和 HCT-116(p53-/-)细胞系, $IC_{50}$ 值分别大于 10 $\mu$ M、10 $\mu$ M、10 $\mu$ M 和 20 $\mu$ M。
<b>体内研究</b>	在 SJS-1 骨肉瘤、RS4;11 急性淋巴细胞白血病、LNCaP 前列腺癌和 HCT-116 结肠癌移植瘤模型中, MI-773(10、30、50、100 和 200mg/kg, p.o.)均可有效抑制肿瘤生长, 其抑制效果为剂量依赖性

### 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)

MB4079	Nutlin-3
MB4080	Nutlin-3a
MB4081	Nutlin-3b

**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。SAR405838 是一种高效的选择性 MDM2 抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.7778 mL	8.8889 mL	17.7778 mL
5 mM		0.3556 mL	1.7778 mL	3.5556 mL
10 mM		0.1778 mL	0.8889 mL	1.7778 mL
50 mM		0.0356 mL	0.1778 mL	0.3556 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验：</b>	荧光偏振结合法： 使用荧光偏振结合法检测 MDM2 抑制剂和 p53 肽与 MDM2 蛋白的亲中性；MI-773 与 Bcl-2、Bcl-xL、Mcl-1 和 $\beta$ -catenin 的亲中性用竞争性荧光偏振结合法检测；与 MDMx 的亲中性用 BioLayer 干涉技术检测。
<b>细胞实验：</b>	Cell lines: SJSA-1、RS4;11、LNCaP、SAOS-2、PC-3、SW620、HCT-116 和 HCT-116(p53-/-)细胞系 Concentrations: 100 $\mu$ M Incubation Time: ~48 小时 Method: 细胞增殖抑制实验用水溶性四氮唑盐法检测，细胞死亡用台盼蓝染色法检测。
<b>动物实验：</b>	Animal Models: 负荷 SJSA-1 骨肉瘤、RS4;11 急性淋巴细胞白血病和 HCT-116 结肠癌的雌性 SCID 小鼠，负荷 LNCaP 前列腺癌的雄性 SCID 小鼠。 Formulation: PBS:PEG400:聚氧乙烯蓖麻油 (10%:3%:87%,v/v/v)或 TPGS:PEG200 (2%:98%, v/v) Dosages: ~200 毫克/千克 Administration: 口服给药

**【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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(M2)	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。